JP10212271

Publication Title:

N-SUBSTITUTED BENZOYLAMINE DERIVATIVE, MEDICINE CONTAINING THE SAME AND INTERMEDIATE FOR PRODUCING THE SAME COMPOUND

Abstract:

Abstract of JP10212271

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain the subject new compound useful as a preventive and treating agent for gastrointestinal tract motion disorders such as indefinite complaint of the upper abdomen, nausea, vomiting, heartburn, anorexia, abdominal pain, feeling of fullness of abdomen, chrinic gastritis, regurgitant esophagus cancer and postagastrectomy syndrome, alleviated in side effects. SOLUTION: This compound is represented by formula I [R1 to R3 are each H, hydroxy, a lower alkyl, etc.; R<4> is H to a lower alkyl; X is furyl, thienyl, etc.; (m) is 0-2; Y is imino or oxygen; (n) is 2-4; Z is a mono or di-lower alkylamino, etc.], e.g. 2-[N-3,4-dimethoxybenzoyl)aminomethyl]-4-[[2-[(2-imidazilidinidene)imino]-ethyl]aminocarbonyl-1,3-thiazole. The compound of formula I is obtained by reacting, e.g. a compound of formula II (U is a halogen, hydroxyl or an alkoxy) with a compound of formula III (V is the same as U) and reacting the resultant compound with a compound represented by the formula T-(CH2)n-Z[Y is Ra NH (Ra is H or an alkyl) or hydroxy]. Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

Courtesy of http://v3.espacenet.com

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平10-212271

(43)公開日 平成10年(1998) 8月11日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号		F I	007/10			
C 0 7 C 237/4 A 6 1 K 31/1 31/3 31/3	165 ACJ 34 38		C 0 7 C A 6 1 K	31/165 31/34 31/38		ACJ	
31/4	12	審査請求	未開求 前次	31/42 R項の数10	FD	(全 32 頁)	最終頁に続く
(21)出願番号	特顧平9-31371		(71)出顧			業株式会社	
(22)出顧日	平成9年(1997)1月31日		(72)発明	東京都者 長澤 埼玉県	中央区 正明 大里郡	日本橋小舟町 江南町大字押	10番11号 切字沼上2512- 社中央研究所内
			(72)発明	者 浅見 埼玉県	一保 大里郡	江南町大字押	切字褶上2512- 社中央研究所内
			(72)発明	埼玉県	大里郡	江南町大字押	切字沼上2512- 社中央研究所内
							最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 N-置換ペンゾイルアミン誘導体、それを含有する医薬及び該化合物の製造中間体

(57)【要約】

【課題】上腹部不定愁訴、悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、腹痛、腹部膨満感、慢性胃炎等に対する予防・治療薬として、消化管運動改善作用を持つ薬剤が期待されている。

【解決手段】下記一般式(I)

【化1】

チアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、フェニル基、ビリジル基等を示し;mは0~2の整数を示し;Yはイミノ基又は酸素原子等を示し;nは2~4の整数を示し;Zはモノ又はジー低級アルキルアミノ基等を表す。」で表される本発明のN-置換ベンゾイルアミン誘導体は強い消化管運動亢進作用を有し、かつ安全性も高いことから優れた消化管運動改善剤として有用でクある。

[式中、 R_1 、 R_2 及び R_3 は同一又は異なって水素原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、アミノ基、シアノ基等を示し; R_4 は水素原子又は低級アルキル基を示し;Xはフリル基、チエニル基、チアゾリル基、イソ

【特許請求の範囲】 【請求項1】 一般式(I)

【化1】

$$\begin{array}{c|c}
R_1 & O & R_4 & O \\
R_2 & C & N & (CH_2) & m & -X & C & -Y & -(CH_2) & n & -Z
\end{array}$$

[式中、R₁、R₂及びR₃は同一又は異なって水素原 子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、ハロ置換低級アル キル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル 基、ハロゲン原子が置換していてもよい低級アルキルカ ルボニル基若しくは低級アルキルスルホニル基、低級ア ルキルカルボニルオキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、 アミノ基、シアノ基、モノ若しくはジー低級アルキルア ミノ基、モノ若しくはジー低級アルキルカルボニルアミ ノ基、モノ若しくはジー低級アルコキシカルボニルアミ ノ基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ホルミルアミ ノ基、モノ若しくはジー低級アルキルアミノアルキルア ミノ基、1-ウレイド基又は2-ピロリルイミノ基を示 すか、 $3cR_1$ と R_2 は 緒になってメチレンジオキシ基 を形成してもよい; R4は水素原子又は低級アルキル基 を示し; Xはハロゲン原子若しくは低級アルキル基が置 換していてもよいフリル基、チエニル基、チアゾリル 基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾ リル基、フェニル基又はピリジル基を示し:mは0~2 の整数を示し(但しXがハロゲン原子若しくは低級アル キル基が置換していてもよいチアゾリル基であるとき は、mは1又は2の整数を示す。);Yは低級アルキル 基が置換していてもよいイミノ基又は酸素原子を示し; nは2~4の整数を示し; Zは下式

【化2】

$$-N < \frac{R_5}{R_s}$$

(式中、 $R_{\bar{\epsilon}}$ 及び $R_{\bar{\epsilon}}$ は同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、比ドロキシカルボニル低級アルキル基、低級アルコキシカルボニルアルキル基又は低級アルコキシアルキル基を示す。)で示される基又は下式

【化3】

$$-N = <_{R_R}^{R_7}$$

(式中、 R_7 、 R_8 は同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基又はヒドロキシカルボニル低級アルキル基を示すか、また R_7 と R_8 は一緒になって含窒素飽和若しくは不飽和複素環式基を形成してもよい。)で示される基を表す。]で表されるN-置換ベンゾイルアミン誘導体又は

その塩、

【請求項2】 R_1 、 R_2 及び R_0 が同一又は異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ニトロ基、アミノ基又はシアノ基である請求項1記載のN 一置換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩。

【請求項3】 R_1 、 R_2 及び R_8 が同一又は異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ニトロ基、アミノ基又はシアノ基であり、 $R_{\rm E}$ 、 R_6 が同一又は異なって水素原子、低級アルキル基又は低級アルコキシ基である請求項1記載のN一置換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩。

【請求項4】 R_1 、 R_2 及び R_3 が同・又は異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ニトロ基、アミノ基又はシアノ基であり、Zがイミダゾリニルイミノ基である請求項1記載のN 一置換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩。

【請求項5】 請求項1~4のいずれかに記載のN-置 換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩を有効成分として 含有する医薬。

【請求項6】 請求項1~4のいずれかに記載のN-置 機ペンゾイルアミン誘導休又はその塩を有効成分として 含有する消化管運動障害の予防・治療剤。

【請求項7】 請求項1~4のいずれかに記載のN-置換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩を有効成分として含有する上腹部不定愁訴、悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、腹痛、腹部膨満感、慢性胃炎、逆流性食道炎、胃切除後症候群の予防・治療剤。

【請求項8】 請求項1~4のいずれかに記載のN 置 換ペンゾイルアミン誘導体又はその塩及び医薬用担体を 含有する医薬組成物。

【請求項9】 消化管運動障害の予防・治療剤である請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】 一般式(II)

【化4】

$$\begin{array}{c|c}
R_1 & 0 & R_4 \\
\hline
R_2 & -C & N - (CH_2) m - x - C - V
\end{array}$$
(11)

[式中、R1、R2及びRgは同一又は異なって水素原

子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、ハロ置換低級アル キル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル 基、ハロゲン原子が置換していてもよい低級アルキルカ ルボニル基若しくは低級アルキルスルホニル基、低級ア ルキルカルボニルオキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、 アミノ基、シアノ基、モノ若しくはジー低級アルキルア ミノ基、モノ若しくはジー低級アルキルカルボニルアミ ノ基、モノ若しくはジー低級アルコキシカルボニルアミ ノ基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ホルミルアミ ノ基、モノ若しくはジー低級アルキルアミノアルキルア ミノ基、1-ウレイド基又は2-ピロリルイミノ基を示 すか、またR₁とR₂は一緒になってメチレンジオキシ基 を形成してもよい; R₄は水素原子又は低級アルキル基 を示し; Xはハロゲン原子若しくは低級アルキル基が置 換していてもよいフリル基、チエニル基、チアゾリル 基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾ リル基、フェニル基又はピリジル基を示し; mは0~2 の整数を示し(但しXがハロゲン原子若しくは低級アル キル基が置換していてもよいチアゾリル基であるとき は、mは1又は2の整数を示す。); Vはハロゲン原 了、ヒドロキシ基又は低級アルコキシ基を示す。]で表 される置換ベンズアミド誘導体又はその塩。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、消化管運動改善作用を有する新規なNー置換ペンゾイルアミン誘導体、そ

れを含有する医薬及び該化合物の製造中間体に関する。 【0002】

【従来の技術】従来、消化管運動障害の治療剤としては、ドンペリドン、メトクロプラミド等の抗ドパミン薬、マレイン酸トリメブチン等のオピエート作動薬、シサプリド等のラHT3 拮抗・5HT4 作動薬、塩化アセチルコリン等のアセチルコリン作動薬等が臨床に用いられている。また、このほかにも消化管運動障害の治療を目的として数多くの消化管運動改善剤の探索がなされている(特開平1-313424号公報、特開平3-163074号公報、特開平4-279581号公報)。

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、必ずしも十分な消化管運動改善作用をもたらすものはなく、また十分な効果を有する薬剤であっても前記各作用機序に起因する副作用が懸念され、必ずしも満足のいくものではなかった。したがって、消化管運動改善作用に優れかつ副作用を軽減した薬剤の開発が望まれていた。

[0003]

【課題を解決するための手段】本発明者らは、かかる実情に鑑み鋭意検討した結果、特定のベンゾイルアミン誘導体が優れた消化管運動改善作用を有し、また副作用を軽減することを見い出し、本発明を完成した。すなわち、本発明は下記一般式(I)

[0004]

【化5】

$$\begin{array}{c|c}
R_1 & 0 & R_4 & 0 \\
R_2 & R_3 & C & N - (CH_2) & M - X - C - Y - (CH_2) & N - Z
\end{array}$$

【0005】 [式中、R1、R2及びR2は同一又は異な って水素原子、ヒドロキシ基、低級アルキル基、ハロ置 換低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシ カルボニル基、ハロゲン原子が置換していてもよい低級 アルキルカルボニル基若しくは低級アルキルスルホニル 基、低級アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲン原子、 ニトロ基、アミノ基、シアノ基、モノ若しくはジー低級 アルキルアミノ基、モノ若しくはジー低級アルキルカル ボニルアミノ基、モノ若しくはジー低級アルコキシカル ボニルアミノ基、低級アルキルスルホニルアミノ基、ホ ルミルアミノ基、モノ若しくはジー低級アルキルアミノ アルキルアミノ基、1 ウレイド基又は2 ピロリルイ ミノ基を示すか、またR₁とR₂は一緒になってメチレン ジオキシ基を形成してもよい;R。は水素原子又は低級 アルキル基を示し; Xはハロゲン原子若しくは低級アル キル基が置換していてもよいフリル基、チエニル基、チ アゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソ オキサゾリル基、フェニル基又はピリジル基を示し; m

は0~2の整数を示し(但しXがハロゲン原子若しくは低級アルキル基が置換していてもよいチアゾリル基であるときは、mは1又は2の整数を示す。); Yは低級アルキル基が置換していてもよいイミノ基又は酸素原子を示し; nは2~4の整数を示し; Zは下式

[0006]

【化6】

$$-N < \frac{R_5}{R_6}$$

【0007】(式中、 R_5 及び R_6 は同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、ヒドロキシカルボニル低級アルキル基、低級アルコキシカルボニルアルキル基又は低級アルコキシアルキル基を示す。)で示される基又は下式【0008】

【化7】

$$-N = <_{R_g}^{R_7}$$

【0009】(式中、R₇、R₈は同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基又はヒドロキシカルボニル低級アルキル基を示すか、またR₇とR₈は一緒になって含窒素飽和若しくは不飽和複素環式基を形成してもよい。)で示される基を表す。]で表されるNー置換ベンゾイルアミン誘導体又はその塩に関する。

【0010】また、本発明は前記N-置換ベンゾイルアミン誘導体(I)又はその塩を有効成分として含有する 医薬に関する。

【0011】さらに、本発明は前記N-置換ベンゾイルアミン誘導体(I)又はその塩を有効成分として含有する上腹部不定愁訴、悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、腹痛、腹部膨満感、慢性胃炎、逆流性食道炎、胃切除後症候群等の消化管運動障害の予防・治療剤に関する。

【0012】さらにまた、本発明は前記N-置換ベンゾイルアミン誘導体(I)又はその塩及び医薬用担体を含有する医薬組成物に関する。

【0013】さらにまた、本発明は前記N-置換ベンゾイルアミン誘導体(I)の製造中間体として有用な下記一般式(II)

[0014]

【化8】

$$\begin{array}{c|c}
R_1 & 0 & R_4 & 0 \\
C & N - (CH_2) m - x - C - V \\
R_2 & (11) & 0
\end{array}$$

【0015】(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、X、mは前記と同意義を示し、Vはハロゲン原子、ヒドロキシ基又は低級アルコキシ基を示す。)で表される置換ベンズアミド誘導体又はその塩に関する。

【0016】木発明において、「低級」とは炭素数1~6の直鎖、分枝状又は環状の炭素鎖を意味する。したがって、「低級アルキル基」としては、炭素数1~6の直鎖、分枝状又は環状のアルキル基(以下、「C1-6アルキル」ということがある。)、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、シクロプロビル基、ブチル基、イソブチル基、secーブチル基、tertーブチル基、シクロブチル基、ペンチル基、1 メチルブチル基、2ーメチルブチル基、イソペンチル基、tertーペンチル基、1、2ージメチルプロピル基、ネオペンチル基、1ーエチルプロピル基、シクロペンチル基、ヘキシル基、1ーメチルペンチル基、2ーメチルペンチル基、3ーメチルペンチル基、1ーエチルブチル基、1ーエチルブチル基、2ーエチルブチル基、1、1ージメチルブチル

基、1,2-ジメチルブチル基、1,3-ジメチルブチル基、2,2-ジメチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、1-メチルー1-エチルプロピル基、1-エチルー2-メチルプロピル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、シクロヘキシル基等が挙げられる。このうち、より好ましい低級アルキル基は炭素数1~4の直鎖又は分枝状のアルキル基である。

【0017】また、「低級アルコキシ基」としては、炭 素数1~6の直鎖、分枝状又は環状のアルコキシ基(以 下、「C₁₋₆アルコキシ」ということがある。)、例え ばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、シクロプロ ポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキ シ基、secーブトキシ基、tertーブトキシ基、シクロブ トキシ基、ペンチルオキシ基、1-メチルブトキシ基、 2-メチルプトキシ基、イソペンチルオキシ基、tert-ペンチルオキシ基、1,2-ジメチルプロポキシ基、ネ オペンチルオキシ基、1-エチルプロポキシ基、シクロ ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、1-メチルペン チルオキシ基、2-メチルペンチルオキシ基、3-メチ ルペンチルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1 エチ ルブトキシ基、2-エチルブトキシ基、1,1-ジメチ ルブトキシ基、1,2-ジメチルブトキシ基、1,3-ジメチルブトキシ基、2,2-ジメチルブトキシ基、 2, 3-ジメチルブトキシ基、3, 3-ジメチルブトキ シ基、1-メチル-1-エチルプロポキシ基、1-エチ ルー2-メチルプロポキシ基、1,1,2-トリメチル プロポキシ基、1,2,2-トリメチルプロポキシ基、 シクロヘキシルオキシ基等が挙げられる。このうち、よ り好ましい低級アルコキシ基は炭素数1~4の直鎖又は 分枝状のアルコキシ基である

【0018】本発明において、「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を意味する。

【0019】「ハロ置換低級アルキル基」とは、前記 「ハロゲン原子」が1個以上置換した低級アルキル基を 意味し、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル 基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロ メチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブ ロモメチル基、トリブロモメチル基、ヨードメチル基、 ジョードメチル基、トリヨードメチル基、1-フルオロ エチル基、2-フルオロエチル基、1,1-ジフルオロ エチル基、1,2-ジフルオロエチル基、2,2-ジフ ルオロエチル基、1,1,2 トリフルオロエチル基、 1,2,2-トリフルオロエチル基、2,2,2-トリ フルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエ チル基、1,2,2,2-テトラフルオロエチル基、ペ ンタフルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロ ロエチル基、1,1-ジクロロエチル基、1,2-ジク ロロエチル基、2,2-ジクロロエチル基、1,1,2

-トリクロロエチル基、1,2,2-トリクロロエチル 基、2,2,2-トリクロロエチル基、1,1,2,2 ーテトラクロロエチル基、1,2,2,2ーテトラクロ ロエチル基、ペンタクロロエチル基、1-プロモエチル 基、2-ブロモエチル基、1、1-ジブロモエチル基、 1,2-ジブロモエチル基、2,2-ジブロモエチル 基、1、1、2ートリブロモエチル基、1、2、2ート リブロモエチル基、2,2,2-トリブロモエチル基、 1, 1, 2, 2-テトラブロモエチル基、1, 2, 2, 2-テトラブロモエチル基、ペンタブロモエチル基、1 -ヨードエチル基、2-ヨードエチル基、1,1-ジョ ードエチル基、1,2-ジョードエチル基、2,2-ジ ヨードエチル基、1,1,2-トリヨードエチル基、 1, 2, 2-トリヨードエチル基、2, 2, 2-トリヨ ードエチル基、1,1,2,2-テトラヨードエチル 基、1,2,2,2ーテトラヨードエチル基、ペンタヨ ードエチル基、1-フルオロプロピル基、2-フルオロ プロビル基、3-フルオロプロピル基、2、3-ジフル オロプロピル基、3,3,3-トリフルオロプロピル 基、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロビル基、 ヘプタフルオロプロピル基、1 クロロプロピル基、2 -クロロプロピル基、3-クロロプロピル基、2、3-ジクロロプロピル基、3,3,3-トリクロロプロピル 基、2,2,3,3,3-ペンタクロロプロピル基、ヘ プタクロロプロピル基、1-ブロモプロピル基、2-ブ ロモプロピル基、3ーブロモプロピル基、2,3ージブ ロモプロピル基、1-ヨードプロピル基、2-ヨードプ ロピル基、3-ヨードプロピル基、2,3-ジョードプ ロピル基等が挙げられる。このうち、トリフルオロメチ ル基、トリクロロメチル基、2,2,2-トリフルオロ エチル基、2,2,2-トリクロロエチル基が特に好ま LN.

【0020】 たドロキシ低級アルキル基」とは、ヒド ロキシ基が1個置換した低級アルキル基を意味し、例え ばヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基、3 ヒドロキシプロピル基、1 -ヒドロキシー2-メチルエチル基、1-ヒドロキシシ クロプロピル基、2-ヒドロキシシクロプロピル基、1 - ヒドロキシブチル基、2 - ヒドロキシブチル基、3 -ヒドロキシブチル基、4-ヒドロキシブチル基、2-ヒ ドロキシー2ーメチルプロピル基、1ーヒドロキシー 2,2-ジメチルエチル基、1-ヒドロキシ-1,2-ジメチルエチル基、1 ヒドロキシペンチル基、2 ヒ ドロキシペンチル基、3-ヒドロキシペンチル基、4-ヒドロキシペンチル基、5-ヒドロキシペンチル基、2 -ヒドロキシ-2-メチルブチル基、3-ヒドロキシ-2-メチルブチル基、4-ヒドロキシー2-メチルブチ ル基、2-ヒドロキシー3-メチルブチル基、3-ヒド ロキシー3-メチルブチル基、4-ヒドロキシー3-メ チルブチル基、2-ヒドロキシー4-メチルブチル基、 3-ヒドロキシー4-メチルブチル基、4-ヒドロキシ -4-メチルブチル基、1-ヒドロキシシクロペンチル 基、2-ヒドロキシシクロペンチル基、3-ヒドロキシ シクロペンチル基、1-ヒドロキシヘキシル基、2-ヒ ドロキシヘキシル基、3-ヒドロキシヘキシル基、4-ヒドロキシヘキシル基、5-ヒドロキシヘキシル基、6 ーヒドロキシヘキシル基、2-ヒドロキシ-2-メチル ペンチル基、2-ヒドロキシ-3-メチルペンチル基、 2-ヒドロキシー4-メチルペンチル基、2-ヒドロキ シー5ーメチルペンチル基、3ーヒドロキシー2ーメチ ルペンチル基、3-ヒドロキシ-3-メチルペンチル 基、3-ヒドロキシー4-メチルペンチル基、3-ヒド ロキシー5ーメチルペンチル基、1-ヒドロキシー2-メチルペンチル基、4-ヒドロキシ-3-メチルペンチ ル基、4-ヒドロキシー4-メチルペンチル基、4-ヒ ドロキシー5ーメチルペンチル基、5ーヒドロキシー2 -メチルペンチル基、5-ヒドロキシ-3-メチルペン チル基、5-ヒドロキシー4-メチルペンチル基、5-ヒドロキシーラーメチルペンチル基、1-ヒドロキシシ クロヘキシル基、2 ヒドロキシシクロヘキシル基、3 ーヒドロキシシクロヘキシル基、4-ヒドロキシシクロ ヘキシル基等が挙げられる。このうち、ヒドロキシーC _-4アルキル基が特に好ましい。

【0021】「ヒドロキシカルボニル低級アルキル基 とは、ヒドロキシカルボニル基が1個置換した低級アル キル基を意味し、例えばヒドロキシカルボニルメチル 基、1-ヒドロキシカルボニルエチル基、2-ヒドロキ シカルボニルエチル基、1-ヒドロキシカルボニルプロ ピル基、2-ヒドロキシカルボニルプロピル基、3-ヒ ドロキシカルボニルプロピル基、1-ヒドロキシカルボ ニルー2-メチルエチル基、1-ヒドロキシカルボニル シクロプロピル基、2-ヒドロキシカルボニルシクロプ ロピル基、1-ヒドロキシカルボニルブチル基、2-ヒ ドロキシカルボニルブチル基、3-ヒドロキシカルボニ ルブチル基、4-ヒドロキシカルボニルブチル基、2-ヒドロキシカルボニル 2 メチルプロピル基、1 ヒ ドロキシカルボニルー2,2-ジメチルエチル基、1-ヒドロキシカルボニルー1, 2-ジメチルエチル基 1 - ヒドロキシカルボニルペンチル基、2-ヒドロキシカ ルボニルペンチル基、3-ヒドロキシカルボニルペンチ ル基、4-ヒドロキシカルボニルペンチル基、5-ヒド ロキシカルボニルペンチル基、2-ヒドロキシカルボニ ル 2 メチルブチル基、3 ヒドロキシカルボニル 2-メチルブチル基、4-ヒドロキシカルボニル-2-メチルブチル基、2-ヒドロキシカルボニル-3-メチ ルブチル基、3-ヒドロキシカルボニル-3-メチルブ チル基、4-ヒドロキシカルボニル-3-メチルブチル 基、2-ヒドロキシカルボニルー4-メチルブチル基、 3-ヒドロキシカルポニル-4-メチルブチル基、4-

ヒドロキシカルボニルー4ーメチルブチル基、1-ヒド ロキシカルボニルシクロペンチル基、2-ヒドロキシカ ルボニルシクロペンチル基、3-ヒドロキシカルボニル シクロペンチル基、1-ヒドロキシカルボニルヘキシル 基、2-ヒドロキシカルボニルヘキシル基、3-ヒドロ キシカルボニルヘキシル基、4-ヒドロキシカルボニル ヘキシル基、5ーヒドロキシカルボニルヘキシル基、6 - ヒドロキシカルボニルヘキシル基、2-ヒドロキシカ ルボニルー2-メチルペンチル基、2-ヒドロキシカル ボニルー3-メチルペンチル基、2-ヒドロキシカルボ ニルー4-メチルペンチル基、2-ヒドロキシカルボニ ルー5ーメチルペンチル基、3ーヒドロキシカルボニル -2-メチルペンチル基、3-ヒドロキシカルボニル-3-メチルペンチル基、3-ヒドロキシカルボニル-1 ーメチルペンチル基、3ーヒドロキシカルボニルー5ー メチルペンチル基、4-ヒドロキシカルボニル-2-メ チルペンチル基、4ーヒドロキシカルボニルー3ーメチ ルペンチル基、4-ヒドロキシカルボニル-4-メチル ペンチル基、4-ヒドロキシカルボニルー5-メチルペー ンチル基、ラーヒドロキシカルボニルー2ーメチルペン チル基、5 ヒドロキシカルボニル 3 メチルペンチ ル基、5-ヒドロキシカルボニル-4-メチルペンチル 基、5-ヒドロキシカルボニル-5-メチルペンチル 基、1-ヒドロキシカルボニルシクロヘキシル基、2-ヒドロキシカルボニルシクロヘキシル基、3-ヒドロキ シカルボニルシクロヘキシル基、4-ヒドロキシカルボ ニルシクロヘキシル基等が挙げられる。 このうち、ヒ ドロキシカルボニルーC1-4アルキル基が特に好まし

【0022】「低級アルキルカルボニル基」とは、炭素 数2~7の直鎖、分枝状又は環状のアルキルカルボニル 基を意味し、「低級アルキルカルボニルオキシ基」とし ては、炭素数2~7の直鎖、分枝状又は環状のアルキル カルボニルオキシ基を意味する、また、「低級アルキル スルホニル基」とは、炭素数1~6の直鎖、分枝状又は 環状のアルキルスルホニル基を意味する。ここで、低級 アルキルカルボニル基、低級アルキルカルボニルオキシ 基及び低級アルキルスルホニル基における低級アルキル 部分としては前記「低級アルキル基」と同様のものが挙 げられる。このうち、好ましいアルキルカルボニル基と してはアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、バレ リル基等が挙げられ、好ましいアルキルカルボニルオキ シ基としては、アセトキシ基、プロピオニルオキシ基、 ブチリルオキシ基、バレリルオキシ基等が挙げられ、好 ましいアルキルスルホニル基としてはメチルスルホニル 基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソ プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチ ルスルホニル基、secーブチルスルホニル基、lertーブ チルスルホニル基等が挙げられる。

【0023】「モノ又はジー低級アルキルアミノ基」と

は、炭素数1~6の直鎖、分枝状又は環状のアルキル基 が1又は2個置換したアミノ基を意味し、例えばメチル アミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプ ロピルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、ブチルアミ ノ基、イソブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、tert -ブチルアミノ基、シクロブチルアミノ基、ペンチルア ミノ基、1-メチルブチルアミノ基、2-メチルブチル アミノ基、イソペンチルアミノ基、tert-ベンチルアミ ノ基、1,2ージメチルプロピルアミノ基、ネオペンチ ルアミノ基、1-エチルプロピルアミノ基、シクロペン チルアミノ基、ヘキシルアミノ基、1-メチルペンチル アミノ基、2-メチルペンチルアミノ基、3-メチルペ ンチルアミノ基、イソヘキシルアミノ基、1-エチルブ チルアミノ基、2-エチルブチルアミノ基、1、1-ジ メチルブチルアミノ基、1,2-ジメチルブチルアミノ 基、1,3ージメチルブチルアミノ基、2,2ージメチ ルブチルアミノ基、2、3-ジメチルブチルアミノ基、 3,3-ジメチルブチルアミノ基、1-メチル-1-エ チルプロピルアミノ基、1-エチル-2-メチルプロピ ルアミノ基、1,1,2-トリメチルプロピルアミノ 基、1,2,2 トリメチルプロピルアミノ基、シクロ ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ 基、ジプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジ ブチルアミノ基、ジイソブチルアミノ基、メチルエチル アミノ基、メチルプロピルアミノ基、メチルイソプロピ ルアミノ基、メチルブチルアミノ基、メチルイソブチル アミノ基、メチルsec-ブチルアミノ基、メチルtert-ブ チルアミノ基、メチルシクロブチルアミノ基、メチルペ ンチルアミノ基、メチル (1-メチル) ブチルアミノ 基、メチル(2-メチル)ブチルアミノ基、メチルイソ ペンチルアミノ基、メチルtert-ペンチルアミノ基、メ チル(1,2-ジメチル)プロピルアミノ基、メチルネ オペンチルアミノ基、メチル (1-エチル) プロピルア ミノ基、メチルシクロペンチルアミノ基、メチルヘキシ ルアミノ基、メチル (1-メチル) ペンチルアミノ基、 メチル (2-メチル) ペンチルアミノ基、メチル (3-メチル) ペンチルアミノ基、メチルイソヘキシルアミノ 基、メチル(1-エチル)ブチルアミノ基、メチル(2 ーエチル) ブチルアミノ基、メチル(1.1-ジメチ ル)ブチルアミノ基、メチル(1,2-ジメチルブチ ル) アミノ基、メチル(1,3-ジメチル) ブチルアミ ノ基、メチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、メ チル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、メチル (3,3 ジメチル) ブチルアミノ基、メチル (1 メ チルー1-エチル) プロピルアミノ基、メチル (1-エ チルー2ーメチル)プロピルアミノ基、メチル(1, 1,2-トリメチル)プロピルアミノ基、メチル(1, 2, 2-トリメチル) プロビルアミノ基、メチルシクロ

【0024】エチルプロピルアミノ基、エチルイソプロ

ヘキシルアミノ基、

ピルアミノ基、エチルブチルアミノ基、エチルイソブチ ルアミノ基、エチルsec-ブチルアミノ基、エチルtert-ブチルアミノ基、エチルシクロブチルアミノ基、エチル ペンチルアミノ基、エチル (1-メチル) ブチルアミノ 基、エチル(2-メチル)ブチルアミノ基、エチルイソ ペンチルアミノ基、エチルtertーペンチルアミノ基、エ チル(1,2-ジメチル)プロピルアミノ基、エチルネ オペンチルアミノ基、エチル (1-エチル) プロピルア ミノ基、エチルシクロペンチルアミノ基、エチルヘキシ ルアミノ基、エチル (1-メチル) ペンチルアミノ基、 エチル(2-メチル)ペンチルアミノ基、エチル(3-メチル) ペンチルアミノ基、エチルイソヘキシルアミノ 基、エチル (1-エチル) ブチルアミノ基、エチル (2 -エチル) ブチルアミノ基、エチル (1,1-ジメチ ル) ブチルアミノ基、エチル(1,2-ジメチル) ブチ ルアミノ基、エチル (1,3-ジメチル) ブチルアミノ 基、エチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、エチ ν (2, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、エチル(3, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、エチル (1-メチルー 1-エチル) プロピルアミノ基、エチル (1-エチルー 2 メチル)プロビルアミノ基、エチル(1,1,2) トリメチル)プロピルアミノ基、エチル(1,2,2-トリメチル) プロピルアミノ基、エチルシクロヘキシル アミノ基、プロピルイソプロピルアミノ基、プロピルブ チルアミノ基、プロピルイソブチルアミノ基、プロピル sec-ブチルアミノ基、プロピルtert-ブチルアミノ基、 プロピルシクロブチルアミノ基、プロピルペンチルアミ ノ基、プロピル(1-メチル)ブチルアミノ基、プロピ ル (2-メチル) ブチルアミノ基、プロピルイソペンチ ルアミノ基、プロピルtert-ペンチルアミノ基、プロピ ル(1,2-ジメチル)プロピルアミノ基、プロピルネ オペンチルアミノ基、プロピル (1-エチル) プロピル アミノ基、プロピルシクロペンチルアミノ基、プロピル ヘキシルアミノ基、プロピル (1-メチル) ペンチルア ミノ基、プロビル (2-メチル) ペンチルアミノ基、ブ ロピル(3-メチル)ペンチルアミノ基、プロピルイソ ヘキシルアミノ基、プロピル (1 エチル) ブチルアミ ノ基、プロピル(2-エチル)ブチルアミノ基、プロピ ν (1,1-ジメチル) ブチルアミノ基、プロピル (1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、プロピル(1, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、プロピル (2, 2-ジ メチル) ブチルアミノ基、プロピル (2,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、プロピル(3,3-ジメチル)ブ チルアミノ基、プロピル(1 メチル 1 エチル)プ ロピルアミノ基、プロピル (1-エチル-2-メチル) プロピルアミノ基、プロピル(1,1,2-トリメチ ル)プロピルアミノ基、プロピル(1,2,2-トリメ チル) プロビルアミノ基、プロビルシクロヘキシルアミ ノ基、イソプロピルブチルアミノ基、 【0025】イソプロピルイソブチルアミノ基、イソプ ロピルsec-ブチルアミノ基、イソプロピルペンチルアミ ノ基、イソプロピル(1-メチル)ブチルアミノ基、イ ソプロピル (2-メチル) ブチルアミノ基、イソプロピ ルイソペンチルアミノ基、イソプロピル(1、2ージメ チル)プロピルアミノ基、イソプロビルネオペンチルア ミノ基、イソプロビル(1-エチル)プロビルアミノ 基、イソプロピルヘキシルアミノ基、イソプロピル(1 ーメチル) ペンチルアミノ基、イソプロピル (2-メチ ル) ペンチルアミノ基、イソプロピル (3-メチル) ペ ンチルアミノ基、イソプロピルイソヘキシルアミノ基、 イソプロピル(1-エチル)ブチルアミノ基、イソプロ ピル(2-エチル) ブチルアミノ基、イソプロピル (1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、イソプロピル (1,3-ジメチル) ブチルアミノ基、イソプロピル (2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、イソプロピル (2, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、イソプロピル (3,3-ジメチル) ブチルアミノ基、イソプロピル (1-メチル-1-エチル)プロピルアミノ基、イソプ ロピル(1-エチルー2-メチル)プロピルアミノ基、 イソプロピル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミ ノ基、ブチルイソブチルアミノ基、ブチルsec-ブチルア ミノ基、ブチルtert-ブチルアミノ基、ブチルシクロブ チルアミノ基、ブチルペンチルアミノ基、ブチル (1-メチル) ブチルアミノ基、ブチル (2-メチル) ブチル アミノ基、ブチルイソペンチルアミノ基、ブチルtert-ペンチルアミノ基、ブチル(1,2-ジメチル)プロピ ルアミノ基、ブチルネオペンチルアミノ基、ブチル(1 ーエチル)プロピルアミノ基、ブチルシクロペンチルア ミノ基、ブチルヘキシルアミノ基、ブチル(1-メチ ル) ペンチルアミノ基、ブチル (2-メチル) ペンチル アミノ基、ブチル (3-メチル) ペンチルアミノ基、ブ チルイソヘキシルアミノ基、ブチル (1-エチル) ブチ ルアミノ基、ブチル(2ーエチル)ブチルアミノ基、ブ チル(1,1-ジメチル)ブチルアミノ基、ブチル (1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、ブチル(1,3 ージメチル) ブチルアミノ基、ブチル (2,2-ジメチ ル) ブチルアミノ基、ブチル(2,3 ジメチル) ブチ ルアミノ基、ブチル(3、3-ジメチル)プチルアミノ 基、ブチル(1-メチル-1-エチル)プロピルアミノ 基、ブチル(1-エチル-2-メチル)プロピルアミノ 基、ブチル(1,1,2-トリメチル)プロピルアミノ 基、ブチル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ 基、ブチルシクロヘキシルアミノ基、 【0026】イソブチルsec-ブチルアミノ基、イソブチ

【0026】イソブチルsec-ブチルアミノ基、イソブチルペンチルアミノ基、イソブチル(1-メチル)ブチルアミノ基、イソブチル(2-メチル)ブチルアミノ基、イソブチルイソペンチルアミノ基、イソブチル・イソブチルネオペンチルアミノ基、イソブチル、プロピルアミノ基、イソブチルへキシルアミノ基、イソブチル(1-メ

チル)ペンチルアミノ基、イソブチル(2-メチル)ペ ンチルアミノ基、イソブチル (3-メチル) ペンチルア ミノ基、イソブチルイソヘキシルアミノ基、イソブチル (1-エチル) ブチルアミノ基、イソブチル (2-エチ ル) ブチルアミノ基、イソブチル(1,1-ジメチル) ブチルアミノ基、イソブチル(1,2-ジメチル)ブチ ルアミノ基、イソブチル(1,3-ジメチル)ブチルア ミノ基、イソブチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、イソブチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、 イソブチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、イソ ブチル (1-メチル-1-エチル) プロピルアミノ基、 イソブチル(1-エチル-2-メチル)プロピルアミノ 基、イソブチル(1,1,2-トリメチル)プロピルア ミノ基、イソブチル(1,2,2-トリメチル)プロピ ルアミノ基、sec-ブチルペンチルアミノ基、sec-ブチル (1-メチル) ブチルアミノ基、sec-ブチル (2-メチ ル)ブチルアミノ基、sec-ブチルイソペンチルアミノ 基、sec-ブチル(1,2-ジメチル)プロピルアミノ 基、sec-ブチルネオペンチルアミノ基、sec-ブチル(1 ーエチル)プロピルアミノ基、sec-ブチルヘキシルアミ ノ基、sec-ブチル(1 メチル)ペンチルアミノ基、se c-ブチル (2-メチル) ペンチルアミノ基、sec-ブチル (3-メチル)ペンチルアミノ基、sec-ブチルイソヘキ シルアミノ基、sec-ブチル (1-エチル) ブチルアミノ 基、sec-ブチル(2-エチル)ブチルアミノ基、sec-ブ チル(1,2-ジメチル)ブチルアミノ基、sec-ブチル (1,3-ジメチル)ブチルアミノ基、sec-ブチル (2, 2-ジメチル) ブチルアミノ基、sec-ブチル (2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、sec-ブチル (3,3-ジメチル) ブチルアミノ基、sec-ブチル (1 -エチル-2-メチル) プロピルアミノ基、sec-ブチル (1, 2, 2-トリメチル) プロビルアミノ基、tert-ブチルペンチルアミノ基、tert-ブチル(2ーメチル) ブチルアミノ基、tert-ブチルイソペンチルアミノ基、t ert-ブチルヘキシルアミノ基、tert-ブチル (2-メチ ル) ペンチルアミノ基、tert-ブチル (3-メチル) ペ ンチルアミノ基、tert-ブチルイソヘキシルアミノ基、t ert-ブチル (2-エチル) ブチルアミノ基、tert-ブチ ル (2, 2-ジメチル) ブチルアミノ基、tert-ブチル (2, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、tert-ブチル (3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、シクロブチルペ ンチルアミノ基、

【0027】シクロブチル(2-メチル)ブチルアミノ基、シクロブチルイソペンチルアミノ基、シクロブチルへキシルアミノ基、シクロブチル(2-メチル)ペンチルアミノ基、シクロブチル(3-メチル)ペンチルアミノ基、シクロブチルイソへキシルアミノ基、シクロブチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、シクロブチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、シクロブチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、シクロブチル(3,3-

ジメチル) ブチルアミノ基、ペンチル (1-メチル) ブ チルアミノ基、ペンチル (2-メチル) ブチルアミノ 基、ペンチルイソペンチルアミノ基、ペンチルtert-ペ ンチルアミノ基、ペンチル(1,2-ジメチル)プロピ ルアミノ基、ペンチルネオペンチルアミノ基、ペンチル (1-エチル) プロピルアミノ基、ペンチルシクロペン チルアミノ基、ペンチルヘキシルアミノ基、ペンチル (1-メチル)ペンチルアミノ基、ペンチル(2-メチ ル) ペンチルアミノ基、ペンチル(3-メチル) ペンチ ルアミノ基、ペンチルイソヘキシルアミノ基、ペンチル (1-エチル) ブチルアミノ基、ペンチル (2-エチ ル) ブチルアミノ基、ペンチル(1,1-ジメチル) ブ チルアミノ基、ペンチル (1,2-ジメチル) ブチルア ミノ基、ペンチル(1,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、ペンチル(2,2ージメチル)ブチルアミノ基、ペ ンチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、ペンチル (3,3-ジメチル) ブチルアミノ基、ペンチル(1-メチルー1-エチル) プロビルアミノ基、ペンチル(1 -エチル-2-メチル) プロピルアミノ基、ペンチル (1, 1, 2-トリメチル)プロピルアミノ基、ペンチ ν (1, 2, 2 トリメチル) プロピルアミノ基、ペン チルシクロヘキシルアミノ基、1-メチルブチル(2-メチル) ブチルアミノ基、1-メチルブチルイソペンチ ルアミノ基、1-メチルブチル(1,2-ジメチル)プ ロピルアミノ基、1-メチルブチルネオペンチルアミノ 基、1-メチルブチル(1-エチル)プロピルアミノ 基、1-メチルブチルヘキシルアミノ基、1-メチルブ チル (1-メチル) ペンチルアミノ基、1-メチルブチ ル (2-メチル) ペンチルアミノ基、1-メチルブチル (3-メチル)ペンチルアミノ基、1-メチルブチルイ ソヘキシルアミノ基、1-メチルブチル(1-エチル) ブチルアミノ基、1-メチルブチル(2-エチル)ブチ ルアミノ基、1-メチルブチル(1,2-ジメチル)ブ チルアミノ基、1-メチルブチルペンチル(1,3-ジ メチル) ブチルアミノ基、1-メチルブチル(2,2-ジメチル) ブチルアミノ基、1-メチルブチル(2,3 ジメチル) ブチルアミノ基、1 メチルブチル(3, 3ージメチル) ブチルアミノ基、1ーメチルブチル(1 -エチルー2-メチル)プロピルアミノ基、1-メチル ブチル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、 【0028】2-メチルブチルイソペンチルアミノ基、 2-メチルブチルtert-ペンチルアミノ基、2-メチル ブチル(1,2-ジメチル)プロピルアミノ基、2-メ チルブチルネオペンチルアミノ基、2 メチルブチル (1-エチル)プロピルアミノ基、2-メチルブチルシ クロペンチルアミノ基、2-メチルブチルヘキシルアミ ノ基、2-メチルブチル(1-メチル)ペンチルアミノ 基、2-メチルブチル(2-メチル)ペンチルアミノ 基、2-メチルブチル (3-メチル) ペンチルアミノ 基、2-メチルプチルイソヘキシルアミノ基、2-メチ ルブチル(1-エチル)ブチルアミノ基、2-メチルブ チル (2-エチル) ブチルアミノ基、2-メチルブチル (1,1-ジメチル) ブチルアミノ基、2-メチルブチ ル(1,2-ジメチル)ブチルアミノ基、2-メチルブ チル(1,3-ジメチル)ブチルアミノ基、2-メチル ブチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、2-メチ ルブチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、2-メ チルブチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、2-メチルブチル (1-メチル-1-エチル) プロピルアミ ノ基、2-メチルプチル(1-エチル-2-メチル)プ ロピルアミノ基、2-メチルブチル(1,1,2-トリ メチル)プロピルアミノ基、2-メチルブチル(1. 2, 2-トリメチル)プロピルアミノ基、2-メチルブ チルシクロヘキシルアミノ基、イソペンチルtert-ペン チルアミノ基、イソペンチル(1,2-ジメチル)プロ ピルアミノ基、イソペンチルネオペンチルアミノ基、イ ソペンチル (1-エチル) プロピルアミノ基、イソペン チルシクロペンチルアミノ基、イソベンチルヘキシルア ミノ基、イソペンチル (1-メチル) ペンチルアミノ 基、イソペンチル(2-メチル)ペンチルアミノ基、イ ソペンチル(3 メチル)ペンチルアミノ基、イソペン チルイソヘキシルアミノ基、イソペンチル(1-エチ ル) ブチルアミノ基、イソペンチル (2-エチル) ブチ ルアミノ基、イソペンチル(1,1-ジメチル)ブチル アミノ基、イソペンチル(1,2-ジメチル)ブチルア ミノ基、イソペンチル(1,3-ジメチル)ブチルアミ ノ基、イソペンチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、イソペンチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、イソペンチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、イソペンチル(1-メチル-1-エチル)プロピル アミノ基、イソペンチル (1-エチル-2-メチル)プ ロピルアミノ基、イソペンチル(1,1,2-トリメチ ル)プロピルアミノ基、イソペンチル(1,2,2-ト リメチル) プロビルアミノ基、イソペンチルシクロヘキ シルアミノ基、tert-ペンチルネオペンチルアミノ基、t ert-ペンチルヘキシルアミノ基、tert-ペンチル (2-メチル) ペンチルアミノ基、tert-ペンチル (3 メチ ル)ペンチルアミノ基、tert-ペンチルイソヘキシルア ミノ基、tert-ペンチル (2-エチル) ブチルアミノ 基、tert-ペンチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、tert-ベンチル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、tert-ペンチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、

【0029】1,2 ジメチルプロビルネオペンチルアミノ基、1,2ージメチルプロピル(1ーエチル)プロピルアミノ基、1,2ージメチルプロピルへキシルアミノ基、1,2ージメチルプロピル(1ーメチル)ペンチルアミノ基、1,2ージメチルプロピル(3ーメチル)ペンチルアミノ基、1,2ージメチルプロピル(3ーメチル)ペンチルアミノ基、1,2ージメチルプロピルイ

ソヘキシルアミノ基、1,2-ジメチルプロピル(1-エチル) ブチルアミノ基、1,2-ジメチルプロピル (2-エチル) ブチルアミノ基、1,2-ジメチルプロ ピル (1, 2-ジメチル) ブチルアミノ基、1, 2-ジ メチルプロピル(1.3-ジメチル)ブチルアミノ基、 1,2-ジメチルプロピル(2,2-ジメチル)ブチル アミノ基、1,2-ジメチルプロピル(2,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、1,2-ジメチルプロピル(3, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、1,2-ジメチルプロ ピル (1-エチル-2-メチル) プロピルアミノ基、 1, 2-ジメチルプロピル(1, 2, 2-トリメチル) プロピルアミノ基、ネオペンチル (1-エチル) プロピ ルアミノ基、ネオペンチルシクロペンチルアミノ基、ネ オペンチルヘキシルアミノ基、ネオペンチル(1-メチ ル) ペンチルアミノ基、ネオペンチル (2-メチル) ペ ンチルアミノ基、ネオペンチル (3-メチル) ペンチル アミノ基、ネオペンチルイソヘキシルアミノ基、ネオペ ンチル (1-エチル) ブチルアミノ基、ネオペンチル (2-エチル) ブチルアミノ基、ネオペンチル(1,1 ージメチル) ブチルアミノ基、ネオペンチル(1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、ネオペンチル (1,3 ジ メチル) ブチルアミノ基、ネオペンチル (2,2-ジメ チル) ブチルアミノ基、ネオペンチル(2,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、ネオペンチル(3,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、ネオペンチル (1-メチル-1-エチル) プロピルアミノ基、ネオペンチル (1-エチル - 2 - メチル) プロピルアミノ基、ネオペンチル(1 . 1,2-トリメチル)プロピルアミノ基、ネオペンチル (1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、ネオペ ンチルシクロヘキシルアミノ基、1-エチルプロピルシ クロペンチルアミノ基、1-エチルプロピルヘキシルア ミノ基、1-エチルプロビル (1-メチル) ペンチルア ミノ基、1-エチルプロピル (2-メチル) ペンチルア ミノ基、1 -エチルプロピル (3 -メチル) ペンチルア ミノ基、1-エチルプロピルイソヘキシルアミノ基、1 -エチルプロピル(1-エチル)ブチルアミノ基、1-エチルプロピル(2 エチル)ブチルアミノ基、1 エ チルプロピル(1,1-ジメチル)ブチルアミノ基、1 -エチルプロピル(1,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、1-エチルプロピル(1,3-ジメチル)ブチルア ミノ基、1-エチルプロピル(2,2-ジメチル)ブチ ルアミノ基、1-エチルプロピル(2,3-ジメチル) ブチルアミノ基、1-エチルプロピル(3,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、1 エチルプロピル (1 エチル -2-メチル) プロピルアミノ基、1-エチルプロピル (1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、シクロ ペンチルヘキシルアミノ基、

【0030】シクロペンチル(2-メチル)ペンチルア ミノ基、シクロペンチル(3-メチル)ペンチルアミノ 基、シクロペンチルイソヘキシルアミノ基、シクロペン チル(2-エチル)ブチルアミノ基、シクロペンチル (2, 2-ジメチル) ブチルアミノ基、シクロペンチル (2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、シクロペンチル (3, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、ヘキシル (1-メチル)ペンチルアミノ基、ヘキシル(2-メチル)ペ ンチルアミノ基、ヘキシル (3-メチル) ペンチルアミ ノ基、ヘキシルイソヘキシルアミノ基、ヘキシル (1-エチルブチル) アミノ基、ヘキシル (2-エチル) ブチ ルアミノ基、ヘキシル(1,1-ジメチルブチル)アミ ノ基、ヘキシル(1,2-ジメチル)ブチルアミノ基、 ヘキシル(1,3-ジメチル)ブチルアミノ基、ヘキシ ル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ基、ヘキシル (2,3-ジメチル)ブチルアミノ基、ヘキシル(3, 3ージメチル) ブチルアミノ基、ヘキシル(1-メチル -1-エチルプロピル) アミノ基、ヘキシル (1-エチ ルー2-メチル)プロピルアミノ基、ヘキシル(1, 1,2-トリメチル)プロピルアミノ基、ヘキシル (1, 2, 2-トリメチル) プロピルアミノ基、ヘキシ ルシクロヘキシルアミノ基、1-メチルペンチル(2-メチル) ペンチルアミノ基、1-メチルペンチル (3-メチル) ペンチルアミノ基、1 メチルペンチルイソへ キシルアミノ基、1-メチルペンチル(1-エチル)ブ チルアミノ基、1-メチルペンチル(2-エチル)ブチ ルアミノ基、1-メチルペンチル(1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、1-メチルペンチル(1,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、1-メチルペンチル(2,2-ジ メチル) ブチルアミノ基、1 -メチルペンチル (2,3) -ジメチル) ブチルアミノ基、1-メチルペンチル (3,3-ジメチル) ブチルアミノ基、1-メチルペン チル(1-エチル-2-メチル)プロピルアミノ基、1 ーメチルペンチル(1,2,2-トリメチル)プロピル アミノ基、2-メチルペンチル (3-メチル) ペンチル アミノ基、2-メチルペンチルイソヘキシルアミノ基、 1-メチルペンチル(1-エチル)ブチルアミノ基、2 -メチルペンチル (2-エチル) ブチルアミノ基、2-メチルペンチル (1,1-ジメチル) ブチルアミノ基、 2 メチルペンチル (1, 2 ジメチル) ブチルアミノ 基、2-メチルペンチル(1,3-ジメチル)ブチルア ミノ基、2-メチルペンチル(2,2-ジメチル)ブチ ルアミノ基、2-メチルペンチル(2,3-ジメチル) ブチルアミノ基、2-メチルペンチル(3,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、2-メチルペンチル(1-メチル -1-エチル)プロピルアミノ基、2-メチルペンチル (1 エチル 2 メチル)プロピルアミノ基、2 メ チルペンチル(1,1,2-トリメチルプロピル)アミ ノ基、2-メチルペンチル(1,2,2-トリメチル) プロピルアミノ基、2-メチルペンチルシクロヘキシル アミノ基、3-メチルペンチルイソヘキシルアミノ基、 【0031】3-メチルペンチル(1-エチル)ブチル アミノ基、3-メチルペンチル (2-エチル) ブチルア

ミノ基、3-メチルペンチル(1,1-ジメチル)ブチ ルアミノ基、3-メチルペンチル(1,2-ジメチル) ブチルアミノ基、3-メチルペンチル(1,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、3-メチルペンチル(2,2-ジ メチル) ブチルアミノ基、3-メチルペンチル(2,3 ージメチル) ブチルアミノ基、3-メチルペンチル (3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、3-メチルペン チル(1-メチル-1-エチル)プロピルアミノ基、3 ーメチルペンチル (1-エチル-2-メチル) プロピル アミノ基、3-メチルペンチル(1,1,2-トリメチ ル)プロピルアミノ基、3-メチルベンチル(1,2, 2-トリメチル)プロピルアミノ基、3-メチルペンチ ルシクロヘキシルアミノ基、イソヘキシル (1-エチ ル) ブチルアミノ基、イソヘキシル(2-エチル) ブチ ルアミノ基、イソヘキシル(1,1-ジメチル)ブチル アミノ基、イソヘキシル(1,2-ジメチル)ブチルア ミノ基、イソヘキシル(1,3-ジメチル)ブチルアミ ノ基、イソヘキシル (2,2-ジメチル) ブチルアミノ 基、イソヘキシル(2,3-ジメチル)ブチルアミノ 基、イソヘキシル (3,3-ジメチル) ブチルアミノ 基、イソヘキシル(1 メチル 1 エチル)プロピル アミノ基、イソヘキシル (1-エチル-2-メチル)プ ロピルアミノ基、イソヘキシル(1,1,2-トリメチ ル)プロピルアミノ基、イソヘキシル(1,2,2-ト リメチル) プロピルアミノ基、イソヘキシルシクロヘキ シルアミノ基、1-エチルブチル (2-エチル) ブチル アミノ基、1-エチルブチル(1,1-ジメチル)ブチ ルアミノ基、1-エチルブチル(1,2-ジメチル)ブ チルアミノ基、1-エチルブチル(1,3-ジメチル) ブチルアミノ基、1-エチルブチル(2,2-ジメチ ル) ブチルアミノ基、1-エチルブチル(2,3-ジメ チル) ブチルアミノ基、1-エチルブチル(3,3-ジ メチル) ブチルアミノ基、1-エチルブチル (1-エチ ルー2-メチル)プロピルアミノ基、1-エチルブチル (1,2,2-トリメチル) プロピルアミノ基、2-エ チルブチル(1,1-ジメチル)ブチルアミノ基、2-エチルプチル(1,2 ジメチル)ブチルアミノ基、2 ーエチルブチル(1,3-ジメチル)ブチルアミノ基、 2-エチルブチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、2-エチルブチル(2,3-ジメチル)ブチルアミ ノ基、2-エチルブチル(3,3-ジメチル)ブチルア ミノ基、2-エチルブチル(1-メチル-1-エチル) プロピルアミノ基、2-エチルブチル(1-エチル-2 メチル)プロピルアミノ基、2 エチルブチル(1, 1,2-トリメチル)プロピルアミノ基、2-エチルブ チル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、2 ーエチルブチルシクロヘキシルアミノ基、 【0032】1、1ージメチルブチル(2、2ージメチ

ル) ブチルアミノ基、1,1-ジメチルブチル(2,3)

-ジメチル) ブチルアミノ基、1,1-ジメチルブチル

(3, 3-ジメチル) ブチルアミノ基、1, 2-ジメチ ルブチル(1,3-ジメチル)ブチルアミノ基、1,2 -ジメチルブチル(2,2-ジメチル)ブチルアミノ 基、1,2-ジメチルブチル(2,3-ジメチル)ブチ ルアミノ基、1,2-ジメチルブチル(3,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、1,2-ジメチルブチル(1-エ チルー2-メチル)プロピルアミノ基、1,2-ジメチ ルブチル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ 基、1、2-ジメチルブチルシクロヘキシルアミノ基、 1,3-ジメチルブチル(2,2-ジメチル)ブチルア ミノ基、1,3-ジメチルブチル(2,3-ジメチル) ブチルアミノ基、1,3-ジメチルブチル(3,3-ジ メチル) ブチルアミノ基、1,3-ジメチルブチル(1 -エチル-2-メチル) プロピルアミノ基、1,3-ジ メチルブチル(1,2,2-トリメチル)プロピルアミ ノ基、1,3-ジメチルブチルシクロヘキシルアミノ 基、2、2ージメチルブチル(2、3ージメチル)ブチ ルアミノ基、2,2-ジメチルブチル(3,3-ジメチ ル) ブチルアミノ基、2,2-ジメチルブチル(1-メ チルー1-エチル)プロピルアミノ基、2,2-ジメチ ルブチル(1 エチル 2 メチル)プロピルアミノ 基、2,2-ジメチルブチル(1,1,2-トリメチ ル)プロピルアミノ基、2,2-ジメチルブチル(1, 2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、2,2-ジメ チルブチルシクロヘキシルアミノ基、2,3-ジメチル ブチル(3,3-ジメチル)ブチルアミノ基、2,3-ジメチルブチル (1-メチル-1-エチル) プロピルア ミノ基、2、3-ジメチルブチル(1-エチル-2-メ チル)プロピルアミノ基、2,3-ジメチルブチル (1,1,2-トリメチル)プロピルアミノ基、2,3 ージメチルブチル(1,2,2-トリメチルプロピル) アミノ基、2,3-ジメチルブチルシクロヘキシルアミ ノ基、3,3ージメチルブチル(1-メチル-1-エチ ルプロピル) アミノ基、3,3-ジメチルブチル(1-エチルー2-メチル) プロピルアミノ基、3,3-ジメ チルブチル(1,1,2-トリメチル)プロピルアミノ 基、3,3 ジメチルブチル(1,2,2 トリメチ ル)プロピルアミノ基、3,3-ジメチルブチルシクロ ヘキシルアミノ基、1-エチル-2-メチルプロピル (1,2,2-トリメチル)プロピルアミノ基、1-エ チルー2-メチルプロピルシクロヘキシルアミノ基、 1,2,2-トリメチルプロピルシクロヘキシルアミノ 基等が挙げられる。このうち、炭素数1~4の直鎖又は 分枝状のアルキル基が1又は2個置換したアミノ基が特 に好ましい。

【0033】 モノ又はジー低級アルキルカルボニルアミノ基」とは、炭素数2~7の直鎖、分枝状又は環状のアルキルカルボニル基が1 Xは2個置換したアミノ基を意味し、例えばアセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、シクロ

プロピルカルボニルアミノ基、バレリルアミノ基、イソ バレリルアミノ基、sec-ブチルカルボニルアミノ基、ピ バロイルアミノ基、シクロブチルカルボニルアミノ基、 ペンチルカルボニルアミノ基、1-メチルブチルカルボ ニルアミノ基、2-メチルブチルカルボニルアミノ基、 イソペンチルカルボニルアミノ基、tert-ペンチルカル ボニルアミノ基、1,2-ジメチルプロピルカルボニル アミノ基、ネオペンチルカルボニルアミノ基、1-エチ ルプロピルカルボニルアミノ基、シクロペンチルカルボ ニルアミノ基、ヘキシルカルボニルアミノ基、1-メチ ルペンチルカルボニルアミノ基、2-メチルペンチルカ ルボニルアミノ基、3-メチルペンチルカルボニルアミ ノ基、イソヘキシルカルボニルアミノ基、1-エチルブ チルカルボニルアミノ基、2-エチルプチルカルボニル アミノ基、1,1-ジメチルブチルカルボニルアミノ 基、1,2-ジメチルブチルカルボニルアミノ基、1, 3-ジメチルブチルカルボニルアミノ基、2.2-ジメ チルブチルカルポニルアミノ基、2,3-ジメチルブチ ルカルボニルアミノ基、3,3-ジメチルブチルカルボ ニルアミノ基、1-メチル-1-エチルプロピルカルボ ニルアミノ基、1 エチル 2 メチルプロピルカルボ ニルアミノ基、1,1,2-トリメチルプロピルカルボ ニルアミノ基、1,2,2-トリメチルプロピルカルボ ニルアミノ基、シクロヘキシルカルボニルアミノ基、ジ アセチルアミノ基、ジプロピオニルアミノ基、ジブチリ ルアミノ基、ジイソブチリルアミノ基、ジバレリルアミ ノ基、ジイソバレリルアミノ基、アセチルプロピオニル アミノ基、アセチルブチリルアミノ基、アセチルイソブ チリルアミノ基、アセチルバレリルアミノ基、プロピオ ニルブチリルアミノ基、プロピオニルイソブチリルアミ ノ基、プロピオニルバレリルアミノ基、ブチリルイソブ チリルアミノ基、ブチリルバレリルアミノ基、イソブチ リルバレリルアミノ基等が挙げられる。このうち、炭素 数2~5の直鎖又は分枝状のアルキル基が1又は2個置 換したアミノ基が特に好ましい。

【0034】本発明において、「低級アルコキシカルボニル基」とは、炭素数2~7の直鎖、分枝状又は環状のアルコキシカルボニル基を意味し、「モノ又はジー低級アルコキシカルボニルアミノ基」とは、炭素数2~7の直鎖、分枝状又は環状のアルコキシカルボニル基が1個又は2個置換したアミノ基を意味する。したがって「モノ又はジー低級アルコキシカルボニルアミノ基」としては、例えばメトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、プロボキシカルボニルアミノ基、イソプロボキシカルボニルアミノ基、イソプロボキシカルボニルアミノ基、ボーメチルブトキシカルボニルアミノ基、シクロブトキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルアミノ基、1ーメチルブトキシカルボニルアミノ基、

2-メチルブトキシカルボニルアミノ基、イソペンチル オキシカルボニルアミノ基、tert-ペンチルオキシカル ボニルアミノ基、1,2-ジメチルプロポキシカルボニ ルアミノ基、ネオペンチルオキシカルボニルアミノ基、 1-エチルプロポキシカルボニルアミノ基、シクロペン チルオキシカルボニルアミノ基、ヘキシルオキシカルボ ニルアミノ基、1-メチルペンチルオキシカルボニルア ミノ基、2-メチルペンチルオキシカルボニルアミノ 基、3-メチルペンチルオキシカルボニルアミノ基、イ ソヘキシルオキシカルボニルアミノ基、1-エチルブト キシカルボニルアミノ基、2-エチルブトキシカルボニ ルアミノ基、1、1ージメチルブトキシカルボニルアミ ノ基、1,2-ジメチルブトキシカルボニルアミノ基、 1,3-ジメチルブトキシカルボニルアミノ基、2,2 ージメチルブトキシカルボニルアミノ基、2,3ージメ チルプトキシカルボニルアミノ基、3,3-ジメチルブ トキシカルボニルアミノ基、1-メチル-1-エチルプ ロポキシカルボニルアミノ基、1-エチルー2-メチル プロポキシカルボニルアミノ基、1,1,2-トリメチ ルプロポキシカルボニルアミノ基、1,2,2-トリメ チルプロポキシカルボニルアミノ基、シクロヘキシルオ キシカルボニルアミノ基、ジメトキシカルボニルアミノ 基、ジエトキシカルボニルアミノ基、メトキシカルボニ ルエトキシカルボニルアミノ基、ジプロポキシカルボニ ルアミノ基、メトキシカルボニルプロポキシカルボニル アミノ基、エトキシカルボニルプロポキシカルボニルア ミノ基、ジシクロプロポキシカルボニルアミノ基、ジイ ソプロポキシカルボニルアミノ基、メトキシカルボニル イソプロポキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニ ルイソプロポキシカルボニルアミノ基、プロポキシカル ボニルイソプロポキシカルボニルアミノ基、ジブトキシ カルボニルアミノ基、

【0035】メトキシカルボニルブトキシカルボニルア ミノ基、エトキシカルボニルブトキシカルボニルアミノ 基、プロポキシカルボニルブトキシカルボニルアミノ 基、イソプロポキシカルボニルブトキシカルボニルアミ ノ基、ジイソブトキシカルボニルアミノ基、メトキシカ ルボニルイソプトキシカルボニルアミノ基、エトキシカ ルボニルイソプトキシカルボニルアミノ基、プロポキシ カルボニルイソブトキシカルボニルアミノ基、イソプロ ポキシカルボニルイソブトキシカルボニルアミノ基、ブ トキシカルボニルイソブトキシカルボニルアミノ基、ジ secーブトキシカルポニルアミノ基、メトキシカルボニ ルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニ ルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、プロポキシカルボ ニルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、イソプロポキシ カルボニルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、ブトキシ カルボニルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、イソブト キシカルボニルsec-ブトキシカルボニルアミノ基、ジte rtーブトキシカルボニルアミノ基、メトキシカルボニル

lert-ブトキシカルボニルアミノ基。エトキシカルボニ ルtert-ブトキシカルボニルアミノ基、プロポキシカル ボニルtertーブトキシカルボニルアミノ基、イソプロポ キシカルボニルtert-ブトキシカルボニルアミノ基、ブ トキシカルボニルtert-ブトキシカルボニルアミノ基、 イソブトキシカルボニルtert-ブトキシカルボニルアミ ノ基、sec-ブトキシカルボニルtert-ブトキシカルボニ ルアミノ基、ジシクロブトキシカルボニルアミノ基、ジ ペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ1-メチルブト キシカルボニルアミノ基、ジ2-メチルブトキシカルボ ニルアミノ基、ジイソペンチルオキシカルポニルアミノ 基、ジtert-ペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ 1, 2-ジメチルプロポキシカルボニルアミノ基、ジネ オペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ1-エチルプ ロボキシカルボニルアミノ基、ジシクロペンチルオキシ カルボニルアミノ基、メトキシカルボニルシクロペンチ ルオキシカルボニルアミノ基。エトキシカルボニルシク ロペンチルオキシカルボニルアミノ基、プロポキシカル ボニルシクロペンチルオキシカルボニルアミノ基、イソ プロポキシカルボニルシクロペンチルオキシカルボニル アミノ基、ブトキシカルボニルシクロペンチルオキシカ ルボニルアミノ基、イソブトキシカルボニルシクロペン チルオキシカルボニルアミノ基、sec-ブトキシカルボニ ルシクロペンチルオキシカルボニルアミノ基、tert-ブ トキシカルボニルシクロベンチルオキシカルボニルアミ ノ基、ペンチルオキシカルボニルシクロペンチルオキシ カルボニルアミノ基、ジヘキシルオキシカルボニルアミ ノ基、メトキシカルボニルヘキシルオキシアミノ基、エ トキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、 プロポキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ 基、イソプロポキシカルボニルヘキシルオキシカルボニ ルアミノ基、プトキシカルボニルヘキシルオキシカルボ ニルアミノ基、イソブトキシカルボニルヘキシルオキシ カルボニルアミノ基、scc-ブトキシカルボニルヘキシル オキシカルボニルアミノ基、

【0036】tert-ブトキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、シクロペンチルオキシカルボニルアミノ基、ネオペンチルオキシカルボニルヘキシルボニルヘキシルボニルへキシルボニルへキシルボニルへキシルボニルへキシルボニルアミノ基、3-メチルブトキシカルボニルアミノ基、3-メチルブトキシカルボニルアミノ基、1 エチルプロボキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、1 エチルプロボキシカルボニルヘキシルオキシカルボニルアミノ基、ジ2-メチルペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ2-メチルペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ3-メチルペンチルオキシカルボニルアミノ基、ジ1-エチルブトキシカルボニルアミノ基、ジ2-エチルブトキシカルボニルアミノ基、ジ2-エチルブトキシカルボニ

ルアミノ基、ジ1、1-ジメチルブトキシカルボニルア ミノ基、ジ1,2-ジメチルブトキシカルボニルアミノ 基、ジ1、3-ジメチルブトキシカルボニルアミノ基、 ジ2,2-ジメチルブトキシカルボニルアミノ基、ジ 2,3-ジメチルブトキシカルボニルアミノ基、ジ3, 3ージメチルブトキシカルボニルアミノ基、ジ1ーメチ ルー1-エチルプロポキシカルボニルアミノ基、ジ1-エチルー2-メチルプロポキシカルボニルアミノ基、ジ 1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニルアミノ 基、ジ1,2,2ートリメチルプロポキシカルボニルア ミノ基、ジシクロヘキシルオキシカルボニルアミノ基、 メトキシカルボニルシクロヘキシルオキシアミノ基、エ トキシカルボニルシクロヘキシルオキシカルボニルアミ ノ基、プロポキシカルボニルシクロヘキシルオキシカル ボニルアミノ基、イソプロボキシカルボニルシクロヘキ シルオキシカルボニルアミノ基、プトキシカルボニルシ クロヘキシルオキシカルボニルアミノ基、イソブトキシ カルボニルシクロヘキシルオキシカルボニルアミノ基、 sec-ブトキシカルボニルシクロヘキシルオキシカルボニ ルアミノ基、tert-ブトキシカルボニルシクロヘキシル オキシカルボニルアミノ基、ペンチルオキシカルボニル シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ基、シクロペン チルオキシカルボニルシクロヘキシルオキシカルボニル アミノ基、ネオペンチルオキシカルボニルシクロヘキシ ルオキシカルボニルアミノ基、1-メチルブトキシカル ボニルシクロヘキシルオキシカルボニルアミノ基、2-メチルブトキシカルボニルシクロヘキシルオキシカルボ ニルアミノ基、3-メチルブトキシカルボニルシクロへ キシルオキシカルボニルアミノ基、1-エチルプロポキ シカルボニルシクロヘキシルオキシカルボニルアミノ基 等が挙げられる。また、「低級アルキルスルホニルアミ ノ基」とは、炭素数1~6の直鎖、分枝状乂は環状のア ルキルスルホニル基が1個置換したアミノ基を意味す

【0037】 モノ又はジー低級アルキルアミノアルキ ルアミノ基」とは、モノ又はジーC1-9アルキルアミノ C₁₋₆アルキルアミノ基を意味し、例えば、メチルア ミノメチルアミノ基、メチルアミノエチルアミノ基、メ チルアミノプロピルアミノ基、メチルアミノブチルアミ ノ基、エチルアミノメチルアミノ基、エチルアミノエチ ルアミノ基、エチルアミノプロピルアミノ基、エチルア ミノブチルアミノ基、プロピルアミノメチルアミノ基プ ロピルアミノエチルアミノ基、プロピルアミノプロピル アミノ基、プロピルアミノブチルアミノ基、イソプロピ ルアミノメチルアミノ基、イソプロピルアミノエチルア ミノ基、イソプロピルアミノプロピルアミノ基、イソプ ロピルアミノブチルアミノ基、ブチルアミノメチルアミ ノ基、ブチルアミノエチルアミノ基、イソブチルアミノ メチルアミノ基、イソブチルアミノエチルアミノ基、se c-ブチルアミノメチルアミノ基、scc-ブチルアミノエチ

ルアミノ基、lerl-ブチルアミノメチルアミノ基、lerl-ブチルアミノエチルアミノ基、ジメチルアミノメチルア ミノ基、ジメチルアミノエチルアミノ基、ジメチルアミ ノプロピルアミノ基、ジメチルアミノブチルアミノ基、 ジエチルアミノメチルアミノ基、ジエチルアミノエチル アミノ基、ジエチルアミノプロピルアミノ基、ジプロピ ルアミノメチルアミノ基、ジプロピルアミノエチルアミ ノ基、ジプロピルアミノプロピルアミノ基、ジイソプロ ピルアミノメチルアミノ基、ジイソプロピルアミノエチ ルアミノ基、ジイソプロピルアミノプロピルアミノ基、 ジブチルアミノエチルアミノ基。ジブチルアミノブチル アミノ基、ジイソブチルアミノメチルアミノ基、ジイソ ブチルアミノブチルアミノ基、メチルエチルアミノメチ ルアミノ基、メチルエチルアミノブチルアミノ基、メチ ルプロピルアミノメチルアミノ基、メチルプロピルアミ ノエチルアミノ基、メチルプロピルアミノプロピルアミ ノ基、メチルプロピルアミノブチルアミノ基、メチルイ ソプロピルアミノメチルアミノ基、メチルイソプロピル アミノエチルアミノ基、メチルイソプロピルアミノプロ ピルアミノ基、メチルイソプロピルアミノブチルアミノ 基、エチルイソプロピルアミノメチルアミノ基、エチル イソプロピルアミノエチルアミノ基、エチルイソプロピ ルアミノプロピルアミノ基、エチルイソプロピルアミノ ブチルアミノ基、エチルプロピルアミノメチルアミノ 基、エチルプロピルアミノエチルアミノ基、エチルプロ ピルアミノプロピルアミノ基、エチルプロピルアミノブ チルアミノ基、メチルブチルアミノメチルアミノ基、メ チルブチルアミノエチルアミノ基、メチルブチルアミノ プロピルアミノ基、メチルブチルアミノブチルアミノ 基、エチルブチルアミノメチルアミノ基、エチルブチル アミノエチルアミノ基、

【0038】エチルブチルアミノプロビルアミノ基、エ チルブチルアミノブチルアミノ基、プロピルブチルアミ ノメチルアミノ基、プロピルブチルアミノエチルアミノ 基、プロピルブチルアミノプロピルアミノ基、プロビル ブチルアミノブチルアミノ基、イソプロピルブチルアミ ノメチルアミノ基、イソプロピルブチルアミノエチルア ミノ基、イソプロピルブチルアミノプロピルアミノ基、 イソプロピルブチルアミノブチルアミノ基、ジシクロプ ロピルアミノメチルアミノ基、ジシクロプロピルアミノ エチルアミノ基、ジシクロプロピルアミノプロピルアミ ノ基、ジシクロプロピルアミノブチルアミノ基、メチル シクロプロピルアミノメチルアミノ基、メチルシクロプ ロピルアミノエチルアミノ基、メチルシクロプロピルア ミノプロピルアミノ基、メチルシクロプロピルアミノブ チルアミノ基、エチルシクロプロピルアミノメチルアミ ノ基、エチルシクロプロピルアミノエチルアミノ基、エ チルシクロプロビルアミノプロビルアミノ基、エチルシ クロプロピルアミノブチルアミノ基、シクロプロピルプ ロピルアミノメチルアミノ基、シクロプロピルプロピル アミノエチルアミノ基、シクロプロピルプロピルアミノブチルアミノ基、シクロプロピルプロピルアミノブチルアミノ基、シクロプロピルイソプロピルアミノメチルアミノ基、シクロプロピルイソプロピルアミノエチルアミノ基、シクロプロピルイソプロピルアミノブチルアミノ基、シクロプロピルイソプロピルアミノブチルアミノ基、シクロプロピルブチルアミノメチルアミノ基、シクロプロピルブチルアミノエチルアミノ基、シクロプロピルブチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノスチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノオルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブラルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブラルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブラルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブラルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブラリアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブチルアミノ基、シクロペンチルメチルアミノブチルアミノ基、

【0039】シクロペンチルエチルアミノメチルアミノ 基、シクロペンチルエチルアミノエチルアミノ基、シク ロペンチルエチルアミノプロピルアミノ基、シクロペン チルエチルアミノブチルアミノ基、シクロペンチルプロ ピルアミノメチルアミノ基、シクロベンチルプロピルア ミノエチルアミノ基、シクロペンチルプロピルアミノプ ロピルアミノ基、シクロペンチルイソプロピルアミノメ チルアミノ基、シクロペンチルイソプロピルアミノエチ ルアミノ基、シクロペンチルイソプロピルアミノプロピ ルアミノ基、シクロペンチルイソプロピルアミノブチル アミノ基、シクロペンチルブチルアミノメチルアミノ 基、シクロベンチルブチルアミノエチルアミノ基、シク ロペンチルブチルアミノプロピルアミノ基、シクロペン チルブチルアミノブチルアミノ基、シクロヘキシルメチ ルアミノメチルアミノ基、シクロヘキシルメチルアミノ エチルアミノ基、シクロヘキシルメチルアミノプロピル アミノ基、シクロヘキシルメチルアミノブチルアミノ 基、シクロヘキシルエチルアミノメチルアミノ基、シク ロヘキシルエチルアミノエチルアミノ基、シクロヘキシ ルエチルアミノプロピルアミノ基、シクロヘキシルエチ ルアミノブチルアミノ基、シクロヘキシルプロビルアミ ノメチルアミノ基、シクロヘキシルプロビルアミノエチ ルアミノ基、シクロヘキシルプロピルアミノプロピルア ミノ基、シクロヘキシルイソプロピルアミノメチルアミ ノ基、シクロヘキシルイソプロピルアミノエチルアミノ 基、シクロヘキシルイソプロピルアミノプロピルアミノ 基、シクロヘキシルイソプロピルアミノブチルアミノ 基、シクロヘキシルブチルアミノメチルアミノ基、シク ロヘキシルブチルアミノエチルアミノ基、シクロヘキシ ルブチルアミノプロピルアミノ基、シクロヘキシルブチ ルアミノブチルアミノ基等が挙げられる。このうち、モ ノ又はジーC₁₋₄アルキルアミノーC₁₋₄アルキルアミノ 基が特に好ましい。

【0040】「低級アルコキシカルボニルアルキル基」 とは、前記「低級アルコキシカルボニル基」が1個置換 したアルキル基を意味し、例えばメトキシカルボニルメ チル基、エトキシカルボニルメチル基、プロボキシカル

ボニルメチル基、シクロプロポキシカルボニルメチル 基、イソプロポキシカルボニルメチル基、ブトキシカル ボニルメチル基、イソブトキシカルボニルメチル基、se cープトキシカルボニルメチル基、tertープトキシカル ボニルメチル基、シクロブトキシカルボニルメチル基、 ペンチルオキシカルボニルメチル基、1-メチルブトキ シカルボニルメチル基、2-メチルブトキシカルボニル メチル基、イソペンチルオキシカルボニルメチル基、te rt-ペンチルオキシカルボニルメチル基、1,2-ジメ チルプロポキシカルボニルメチル基、ネオペンチルオキ シカルボニルメチル基、1-エチルプロポキシカルボニ ルメチル基、シクロペンチルオキシカルボニルメチル 基、ヘキシルオキシカルボニルメチル基、1-メチルペ ンチルオキシカルボニルメチル基、2-メチルペンチル オキシカルボニルメチル基、3-メチルペンチルオキシ カルボニルメチル基、イソヘキシルオキシカルボニルメ チル基、1-エチルブトキシカルボニルメチル基、2-エチルプトキシカルボニルメチル基、1,1-ジメチル ブトキシカルボニルメチル基、1,2-ジメチルブトキ シカルボニルメチル基、1.3-ジメチルブトキシカル ボニルメチル基、2,2 ジメチルプトキシカルボニル メチル基、2,3-ジメチルプトキシカルボニルメチル 基、3,3-ジメチルブトキシカルボニルメチル基、1 ーメチルー1ーエチルプロポキシカルボニルメチル基、 1-エチルー2-メチルプロポキシカルボニルメチル 基、1、1、2-トリメチルプロポキシカルボニルメチ ル基、1,2,2-トリメチルプロポキシカルボニルメ チル基、シクロヘキシルオキシカルボニルメチル基、1 ーメトキシカルボニルエチル基、1-エトキシカルボニ ルエチル基、1-プロボキシカルボニルエチル基、1-シクロプロポキシカルボニルエチル基、1-イソプロポ キシカルボニルエチル基、1-ブトキシカルボニルエチ ル基、1-イソプトキシカルボニルエチル基、1-sec ープトキシカルボニルエチル基、1-tertープトキシカ ルボニルエチル基、1-シクロブトキシカルボニルエチ ル基、1-ペンチルオキシカルボニルエチル基、1-(1 メチルプトキシカルボニル) エチル基、1 (2 ーメチルブトキシカルボニル) エチル基、1-イソペン チルオキシカルボニルエチル基、1-tert-ペンチルオ キシカルボニルエチル基、1-(1,2-ジメチルプロ ポキシカルボニル) エチル基、1-ネオペンチルオキシ カルボニルエチル基、1-(1-エチルプロポキシカル ボニル) エチル基、1-シクロペンチルオキシカルボニ ルエチル基、1 ヘキシルオキシカルボニルエチル基、 **1-(1-メチルペンチルオキシカルボニル)エチル** 基、1-(2-メチルペンチルオキシカルボニル) エチ ル基、1-(3-メチルペンチルオキシカルボニル) エ チル基、1-イソヘキシルオキシカルボニルエチル基、 1-(1-エチルブトキシカルボニル) エチル基、1-(2-エチルブトキシカルボニル) エチル基、1(1, 1-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(1, 2-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(1, 3-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(2, 2-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(2, 3-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(3, 3-i)メチルブトキシカルボニル)エチル基、1-(1-i)メチルプロポキシカルボニル)エチル基、1-(1-i)ロポキシカルボニル)エチル基、1-(1-i)ロポキシカルボニル)エチル基、1-(1, 1, 2-i)

【0041】1-(1,2,2-トリメチルプロポキシ カルボニル) エチル基、1 - シクロヘキシルオキシカル ボニルエチル基、2-メトキシカルボニルエチル基、2 ーエトキシカルボニルエチル基、2-プロポキシカルボ ニルエチル基、2-シクロプロポキシカルボニルエチル 基、2-イソプロポキシカルボニルエチル基、2-ブト キシカルボニルエチル基、2-イソブトキシカルボニル エチル基、2-sec-ブトキシカルボニルエチル基、2 -tert-ブトキシカルボニルエチル基、2-シクロブト キシカルボニルエチル基、2-ペンチルオキシカルボニ ルエチル基、2 (1 メチルブトキシカルボニル)エ チル基、2-(2-メチルブトキシカルボニル) エチル 基、2-イソペンチルオキシカルボニルエチル基、2tert-ペンチルオキシカルボニルエチル基、2-(1. 2-ジメチルプロポキシカルボニル) エチル基、2-ネ オペンチルオキシカルボニルエチル基、2-(1-エチ ルプロポキシカルボニル) エチル基、2-シクロペンチ ルオキシカルボニルエチル基、2-ヘキシルオキシカル ボニルエチル基、2-(1-メチルペンチルオキシカル ボニル) エチル基、2-(2-メチルペンチルオキシカ ルボニル) エチル基、2-(3-メチルペンチルオキシ カルボニル) エチル基、2-イソヘキシルオキシカルボ ニルエチル基、2-(1-エチルブトキシカルボニル) エチル基、2-(2-エチルブトキシカルボニル)エチ ル基、2-(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)エ チル基、2-(1,2-ジメチルブトキシカルボニル) エチル基、2 (1,3 ジメチルブトキシカルボニ ル) エチル基、2-(2,2-ジメチルブトキシカルボ ニル) エチル基、2-(2,3-ジメチルブトキシカル ボニル) エチル基、2-(3,3-ジメチルブトキシカ ルボニル) エチル基、2-(1-メチル-1-エチルプ ロポキシカルボニル) エチル基、2-(1-エチル-2 -メチルプロポキシカルボニル) エチル基、2-(1. 1,2 トリメチルプロポキシカルボニル)エチル基、 2-(1, 2, 2-トリメチルプロポキシカルボニル) エチル基、2-シクロヘキシルオキシカルボニルエチル 基、1-メトキシカルボニルプロピル基、1-エトキシ カルボニルプロビル基、1-プロポキシカルボニルプロ ピル基、1-シクロプロポキシカルボニルプロビル基、 1-イソプロポキシカルボニルプロピル基、1-ブトキ シカルボニルプロピル基、1-イソブトキシカルボニルプロピル基、1-sec-ブトキシカルボニルプロピル基、1-bert-ブトキシカルボニルプロピル基、1-シクロブトキシカルボニルプロピル基、1-ペンチルオキシカルボニルプロピル基、1-(1-メチルブトキシカルボニル)プロピル基、1-(2-メチルブトキシカルボニル)プロピル基、1-イソペンチルオキシカルボニルプロピル基、1-tert-ペンチルオキシカルボニルプロピル基、1-(1,2-ジメチルプロポキシカルボニル)プロピル基、

【0042】1-ネオペンチルオキシカルボニルプロピ ル基、1-(1-エチルプロポキシカルボニル) プロピ ル基、1-シクロペンチルオキシカルボニルプロピル 基、1-ヘキシルオキシカルボニルプロピル基、1-(1-メチルペンチルオキシカルボニル)プロビル基、 1-(2-メチルペンチルオキシカルボニル)プロピル 基、1-(3-メチルペンチルオキシカルボニル)プロ ピル基、1-イソヘキシルオキシカルボニルプロピル 基、1-(1-エチルブトキシカルボニル) プロピル 基、1-(2-エチルブトキシカルボニル)プロピル 基、1 (1,1 ジメチルブトキシカルボニル)プロ ピル基、1-(1,2-ジメチルブトキシカルボニル) プロピル基、1-(1,3-ジメチルブトキシカルボニ ル)プロピル基、1-(2,2-ジメチルブトキシカル ボニル) プロピル基、1-(2,3-ジメチルブトキシ カルボニル)プロピル基。1-(3,3-ジメチルブト キシカルボニル)プロピル基、1-(1-メチル-1-エチルプロポキシカルボニル)プロピル基、1-(1-エチルー2-メチルプロポキシカルボニル) プロピル 基、1-(1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニ ル)プロピル基、1-(1,2,2-トリメチルプロポ キシカルボニル) プロビル基、1-シクロヘキシルオキ シカルボニルプロピル基、2-メトキシカルボニルプロ ピル基、2-エトキシカルボニルプロピル基、2-プロ ボキシカルボニルプロビル基、2-シクロプロボキシカ ルボニルプロピル基、2-イソプロポキシカルボニルプ ロピル基、2 プトキシカルボニルプロピル基、2 イ ソブトキシカルボニルプロピル基、2-sec-ブトキシ カルボニルプロピル基、2-tert-ブトキシカルボニル プロピル基、2-シクロブトキシカルボニルプロピル 基、2-ペンチルオキシカルボニルプロピル基、2-(1-メチルブトキシカルボニル)プロピル基、2-(2-メチルブトキシカルボニル)プロピル基、2-イ ソペンチルオキシカルボニルプロピル基、2 tert ペ ンチルオキシカルボニルプロピル基、2-(1,2-ジ メチルプロポキシカルボニル)プロビル基、2-ネオペ ンチルオキシカルボニルプロピル基、2-(1-エチル プロボキシカルボニル)プロビル基、2-シクロペンチ ルオキシカルボニルプロピル基、2-ヘキシルオキシカ ルボニルプロピル基、2-(1-メチルペンチルオキシ

カルボニル)プロピル基、2-(2-メチルペンチルオ キシカルボニル) プロピル基、2-(3-メチルペンチ ルオキシカルボニル) プロピル基、2-イソヘキシルオ キシカルボニルプロピル基、2-(1-エチルブトキシ カルボニル)プロピル基、2-(2-エチルブトキシカ ルボニル)プロビル基、2-(1,1-ジメチルブトキ シカルボニル)プロピル基、2-(1,2-ジメチルブ トキシカルボニル)プロピル基、2-(1,3-ジメチ ルブトキシカルボニル)プロピル基、2-(2,2-ジ メチルブトキシカルボニル) プロピル基、2-(2,3) -ジメチルブトキシカルボニル)プロピル基、2-(3,3-ジメチルプトキシカルボニル)プロピル基、 2-(1-メチル-1-エチルプロポキシカルボニル) プロビル基、2-(1-エチル-2-メチルプロポキシ カルボニル)プロピル基、2-(1,1,2-トリメチ ルプロポキシカルボニル) プロピル基、2-(1,2, 2-トリメチルプロポキシカルボニル)プロピル基、 【0043】2-シクロヘキシルオキシカルボニルプロ ピル基、3-メトキシカルボニルプロピル基、3-エト キシカルボニルプロピル基、3ープロポキシカルボニル プロピル基、3 シクロプロボキシカルボニルプロピル 基、3-イソプロポキシカルボニルプロピル基、3-ブ トキシカルボニルプロピル基、3-イソブトキシカルボ ニルプロピル基、3-sec-ブトキシカルボニルプロピ ル基、3-tert-ブトキシカルボニルプロピル基、3-シクロブトキシカルボニルプロピル基、3ーペンチルオ キシカルボニルプロピル基、3-(1-メチルブトキシ カルボニル)プロピル基、3-(2-メチルブトキシカ ルボニル)プロビル基、3-イソペンチルオキシカルボ ニルプロピル基、3-tert-ペンチルオキシカルボニル プロピル基、3-(1,2-ジメチルプロポキシカルボ ニル)プロビル基、3-ネオペンチルオキシカルボニル プロピル基、3-(1-エチルプロポキシカルボニル) プロピル基、3-シクロペンチルオキシカルボニルプロ ビル基、3-ヘキシルオキシカルボニルプロビル基、3 - (1-メチルペンチルオキシカルボニル)プロピル 基、3 (2 メチルペンチルオキシカルボニル)プロ ピル基、3-(3-メチルペンチルオキシカルボニル) プロピル基、3-イソヘキシルオキシカルボニルプロピ ル基、3-(1-エチルブトキシカルボニル) プロピル 基、3-(2-エチルブトキシカルボニル)プロピル 基、3-(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)プロ \mathbb{C} ル基、3-(1,2-i)メチルブトキシカルボニル) プロピル基、3 (1,3 ジメチルブトキシカルボニ ル)プロピル基、3-(2,2-ジメチルブトキシカル ボニル)プロピル基、3-(2,3-ジメチルブトキシ カルボニル)プロピル基、3-(3,3-ジメチルブト キシカルボニル) プロピル基、3-(1-メチル-1-エチルプロポキシカルボニル)プロピル基、3-(1-エチルー2-メチルプロポキシカルボニル)プロピル

基、3-(1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニ ル)プロピル基、3-(1,2,2-トリメチルプロポ キシカルボニル) プロピル基、3-シクロヘキシルオキ シカルボニルプロピル基、1-メトキシカルボニルブチ ル基、1-エトキシカルボニルブチル基、1-プロポキ シカルボニルブチル基、1-シクロプロポキシカルボニ ルブチル基、1-イソプロポキシカルボニルブチル基、 1-ブトキシカルボニルブチル基、1-イソブトキシカ ルボニルブチル基、1-sec-ブトキシカルボニルブチ ル基、1-tert-ブトキシカルボニルブチル基、1-シ クロブトキシカルボニルブチル基、1-ペンチルオキシ カルボニルブチル基、1-(1-メチルブトキシカルボ ニル) ブチル基、1-(2-メチルブトキシカルボニ ル) ブチル基、1-イソペンチルオキシカルボニルブチ ル基、1-tert-ベンチルオキシカルボニルブチル基、 1-(1,2-ジメチルプロポキシカルボニル)ブチル 基、1-ネオペンチルオキシカルボニルブチル基、1-(1-エチルプロポキシカルボニル) ブチル基、1-シ クロペンチルオキシカルボニルブチル基、1-ヘキシル オキシカルボニルブチル基、1-(1-メチルペンチル オキシカルボニル) ブチル基、1 (2 メチルペンチ ルオキシカルボニル) ブチル基、1-(3-メチルペン チルオキシカルボニル) ブチル基、1-イソヘキシルオ キシカルボニルブチル基、1-(1-エチルブトキシカ ルボニル)ブチル基、1-(2-エチルブトキシカルボ ニル)ブチル基、1-(1,1-ジメチルブトキシカル ボニル) ブチル基、1-(1,2-ジメチルブトキシカ ルボニル) ブチル基、1-(1,3-ジメチルブトキシ カルボニル) ブチル基、1-(2,2-ジメチルブトキ シカルボニル)ブチル基、

【0044】1-(2,3-ジメチルブトキシカルボニ ル) ブチル基、1-(3,3-ジメチルブトキシカルボ ニル)ブチル基、1-(1-メチル-1-エチルプロポ キシカルボニル) ブチル基、1-(1-エチル-2-メ チルプロポキシカルボニル) ブチル基、1-(1,1, 2-トリメチルプロポキシカルボニル) ブチル基、1-(1,2,2 トリメチルプロポキシカルボニル) ブチ ル基、1-シクロヘキシルオキシカルボニルブチル基、 2-メトキシカルボニルブチル基、2-エトキシカルボ ニルブチル基、2-プロポキシカルボニルブチル基、2 -シクロプロポキシカルボニルブチル基、2-イソプロ ポキシカルボニルブチル基、2-ブトキシカルボニルブ チル基、2-イソブトキシカルボニルブチル基、2-se c ブトキシカルボニルブチル基、2 tert ブトキシ カルボニルブチル基、2-シクロブトキシカルボニルブ チル基、2-ペンチルオキシカルボニルブチル基、2-(1-メチルブトキシカルボニル) ブチル基、2-(2 ーメチルブトキシカルボニル) ブチル基、2-イソペン チルオキシカルボニルブチル基、2-tert-ペンチルオ キシカルボニルブチル基、2-(1,2-ジメチルプロ

ポキシカルボニル)ブチル基、2-ネオペンチルオキシ カルボニルブチル基、2-(1-エチルプロポキシカル ボニル) ブチル基、2-シクロペンチルオキシカルボニ ルブチル基、2-ヘキシルオキシカルボニルブチル基、 2-(1-メチルペンチルオキシカルボニル)ブチル 基、2-(2-メチルペンチルオキシカルポニル)ブチ ル基、2-(3-メチルペンチルオキシカルボニル)ブ チル基、2-イソヘキシルオキシカルボニルブチル基、 2-(1-エチルブトキシカルボニル) ブチル基、2-(2-エチルブトキシカルボニル) ブチル基、2-(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)ブチル基、2 - (1,2-ジメチルブトキシカルボニル)ブチル基、 2-(1,3-ジメチルブトキシカルボニル)ブチル 基、2-(2,2-ジメチルブトキシカルボニル)ブチ ル基、2-(2,3-ジメチルプトキシカルボニル)ブ チル基、2-(3,3-ジメチルブトキシカルボニル) ブチル基、2-(1-メチル-1-エチルプロポキシカ ルボニル) ブチル基、2-(1-エチル-2-メチルプ ロポキシカルボニル) ブチル基、2-(1,1,2-ト リメチルプロポキシカルボニル) ブチル基、2-(1, 2,2 トリメチルプロポキシカルボニル) ブチル基、 2-シクロヘキシルオキシカルボニルブチル基、3-メ トキシカルボニルブチル基、3-エトキシカルボニルブ チル基、3-プロポキシカルボニルブチル基、3-シク ロプロポキシカルボニルブチル基、3-イソプロポキシ カルボニルブチル基、3-ブトキシカルボニルブチル 基、3-イソブトキシカルボニルブチル基、3-scc-プトキシカルボニルブチル基、3-tert-ブトキシカル ボニルブチル基、3-シクロブトキシカルボニルブチル 基、3-ペンチルオキシカルボニルブチル基、3-(1) -メチルブトキシカルボニル)ブチル基、 【0045】3-(2-メチルプトキシカルボニル)ブ

チル基、3-イソペンチルオキシカルボニルブチル基、 3-tert-ペンチルオキシカルボニルブチル基、3-(1,2-ジメチルプロポキシカルボニル)ブチル基、 3-ネオペンチルオキシカルボニルブチル基、3-(1 エチルプロポキシカルボニル) ブチル基、3 シクロ ペンチルオキシカルボニルブチル基、3-ヘキシルオキ シカルボニルブチル基、3-(1-メチルペンチルオキ シカルボニル) ブチル基、3-(2-メチルペンチルオ キシカルボニル) ブチル基、3-(3-メチルペンチル オキシカルボニル)ブチル基、3-イソヘキシルオキシ カルボニルブチル基、3-(1-エチルブトキシカルボ ニル) ブチル基、3 (2 エチルブトキシカルボニ ル) ブチル基、3-(1,1-ジメチルブトキシカルボ ニル) ブチル基、3-(1,2-ジメチルブトキシカル ボニル) ブチル基、3-(1,3-ジメチルブトキシカ ルボニル) ブチル基、3-(2.2-ジメチルブトキシ カルポニル) ブチル基、3-(2,3-ジメチルブトキ シカルボニル) ブチル基、3-(3,3-ジメチルブト キシカルボニル) ブチル基、3-(1-メチル-1-エ チルプロポキシカルボニル) ブチル基、3-(1-エチ ルー2-メチルプロポキシカルボニル) ブチル基、3-(1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニル)ブチ ル基、3-(1,2,2-トリメチルプロポキシカルボ ニル) ブチル基、3-シクロヘキシルオキシカルボニル ブチル基、1-メトキシカルボニルブチル基、1-エト キシカルボニルブチル基、4-プロポキシカルボニルブ チル基、4-シクロプロポキシカルボニルブチル基、4 ーイソプロポキシカルボニルブチル基。4ープトキシカ ルボニルブチル基、4-イソブトキシカルボニルブチル 基、4-sec-ブトキシカルボニルブチル基、4-tert ープトキシカルポニルブチル基、4ーシクロプトキシカ ルボニルブチル基、イーペンチルオキシカルボニルブチ ル基、4-(1-メチルブトキシカルボニル) ブチル 基、4-(2-メチルブトキシカルボニル)ブチル基、 4-イソペンチルオキシカルボニルブチル基、4-tert -ペンチルオキシカルボニルブチル基、4-(1,2-ジメチルプロポキシカルボニル) ブチル基、4-ネオペ ンチルオキシカルボニルブチル基、4-(1-エチルプ ロポキシカルボニル)ブチル基、4 シクロペンチルオ キシカルボニルブチル基、4-ヘキシルオキシカルボニ ルブチル基、4-(1-メチルペンチルオキシカルボニ ル) ブチル基、4-(2-メチルペンチルオキシカルボ ニル) ブチル基、4-(3-メチルペンチルオキシカル ボニル) ブチル基、4-イソヘキシルオキシカルボニル ブチル基、4-(1-エチルブトキシカルボニル) ブチ ル基、4-(2-エチルブトキシカルボニル) ブチル 基、4-(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)ブチ ル基、4-(1,2-ジメチルブトキシカルボニル)プチル基、4 - (1, 3 - ジメチルブトキシカルボニル)ブチル基、4-(2,2-ジメチルブトキシカルボニ ν) ブチル基、4-(2,3-i)メチルブトキシカルボ ニル)ブチル基、

【0046】4-(3,3-ジメチルブトキシカルボニ ル) ブチル基、4-(1-メチル-1-エチルプロポキ シカルボニル) ブチル基、4 (1 エチル 2 メチ ルプロポキシカルボニル)ブチル基、4-(1,1,2 ートリメチルプロポキシカルボニル) ブチル基、4-(1,2,2-トリメチルプロポキシカルボニル)ブチ ル基、4-シクロヘキシルオキシカルボニルブチル基、 1-メトキシカルボニルペンチル基、1-エトキシカル ボニルペンチル基、1-プロポキシカルボニルペンチル 基、1 シクロプロポキシカルボニルペンチル基、1 イソプロポキシカルボニルペンチル基、1-ブトキシカ ルボニルペンチル基、1-イソブトキシカルボニルペン チル基、1-sec-ブトキシカルボニルペンチル基、1 ーlerlーブトキシカルボニルペンチル基、1 – シクロブ トキシカルボニルペンチル基、1-ペンチルオキシカル ボニルペンチル基、1-(1-メチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、1-(2-メチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、1-イソペンチルオキシカルボニルペ ンチル基、1 -tert-ペンチルオキシカルボニルペンチ ル基、1-(1,2-ジメチルプロポキシカルボニル) ペンチル基、1-ネオペンチルオキシカルボニルペンチ ル基、1-(1-エチルプロポキシカルボニル)ペンチ ル基、1-シクロペンチルオキシカルボニルペンチル 基、1-ヘキシルオキシカルボニルペンチル基、1-(1-メチルペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、 1-(2-メチルペンチルオキシカルボニル)ペンチル 基、1-(3-メチルペンチルオキシカルボニル)ペン チル基、1-イソヘキシルオキシカルボニルペンチル 基、1-(1-エチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、1-(2-エチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、1-(1,1-ジメチルプトキシカルボニル)ベン チル基、1-(1,2-ジメチルブトキシカルボニル) ペンチル基、1-(1,3-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル基、1-(2,2-ジメチルブトキシカル ボニル)ペンチル基、1-(2.3-ジメチルブトキシ カルボニル)ペンチル基、1-(3,3-ジメチルブト キシカルボニル)ペンチル基、1 (1 メチル 1 エチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、1-(1-エチルー2ーメチルプロポキシカルボニル)ペンチル 基、1-(1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニ ル)ペンチル基、1-(1,2,2-トリメチルプロポ キシカルボニル)ペンチル基、1-シクロヘキシルオキ シカルボニルペンチル基、2-メトキシカルボニルペン チル基、2-エトキシカルボニルペンチル基、

【0047】2-プロポキシカルボニルペンチル基、2 ーシクロプロポキシカルボニルペンチル基、2-イソプ ロポキシカルボニルペンチル基、2-ブトキシカルボニ ルペンチル基、2-イソブトキシカルボニルペンチル 基、2-sec-ブトキシカルボニルペンチル基。2-ter tーブトキシカルボニルペンチル基、2-シクロブトキ シカルボニルペンチル基、2-ペンチルオキシカルボニ ルペンチル基、2-(1-メチルブトキシカルボニル) ペンチル基、2 (2 メチルブトキシカルボニル)ペ ンチル基、2-イソペンチルオキシカルボニルペンチル 基、2-tert-ペンチルオキシカルボニルペンチル基、 2-(1,2-ジメチルプロボキシカルボニル)ペンチ ル基、2-ネオペンチルオキシカルボニルペンチル基、 2-(1-エチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、 2-シクロペンチルオキシカルボニルペンチル基、2-ヘキシルオキシカルボニルペンチル基、2 (1 メチ ルペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、2-(2-メチルペンチルオキシカルボニル) ペンチル基、2-(3-メチルペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、 2-イソヘキシルオキシカルボニルペンチル基、2-(1-エチルブトキシカルボニル)ペンチル基、2-(2-エチルブトキシカルボニル)ペンチル基、2-

(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル基、 2-(1, 2-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、2-(1,3-ジメチルブトキシカルボニル)ペン チル基、2-(2,2-ジメチルブトキシカルボニル) ペンチル基、2-(2,3-ジメチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、2-(3,3-ジメチルプトキシカル ボニル)ペンチル基、2-(1-メチル-1-エチルプ ロポキシカルボニル)ペンチル基、2-(1-エチルー 2-メチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、2-(1, 1, 2-トリメチルプロポキシカルボニル)ペン チル基、2-(1,2,2-トリメチルプロポキシカル ボニル) ペンチル基、2-シクロヘキシルオキシカルボ ニルペンチル基、3-メトキシカルボニルペンチル基、 3-エトキシカルボニルペンチル基、3-プロポキシカ ルボニルペンチル基、3ーシクロプロポキシカルボニル ペンチル基、3-イソプロボキシカルボニルペンチル 基、3-ブトキシカルボニルペンチル基、3-イソブト キシカルボニルペンチル基、3-sec-ブトキシカルボ ニルペンチル基、3-tert-ブトキシカルボニルペンチ ル基、3-シクロブトキシカルボニルペンチル基、3-ペンチルオキシカルボニルペンチル基、3 (1 メチ ルブトキシカルボニル)ペンチル基、3-(2-メチル ブトキシカルボニル)ペンチル基、3-イソペンチルオ キシカルボニルペンチル基、3-tert-ペンチルオキシ カルボニルペンチル基、3-(1,2-ジメチルプロポ キシカルボニル)ペンチル基、3-ネオペンチルオキシ カルボニルペンチル基、3-(1-エチルプロポキシカ ルボニル)ペンチル基、3-シクロペンチルオキシカル ボニルペンチル基、3-ヘキシルオキシカルボニルペン チル基、

【0048】3-(1-メチルペンチルオキシカルボニ ル)ペンチル基、3-(2-メチルペンチルオキシカル ボニル)ペンチル基、3-(3-メチルペンチルオキシ カルボニル)ペンチル基、3-イソヘキシルオキシカル ボニルペンチル基、3-(1-エチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、3-(2-エチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、3 (1,1 ジメチルブトキシカル ボニル)ペンチル基、3-(1,2-ジメチルブトキシ カルボニル)ペンチル基、3-(1,3-ジメチルブト キシカルボニル)ペンチル基、3-(2,2-ジメチル ブトキシカルボニル)ペンチル基、3-(2,3-ジメ チルブトキシカルボニル)ペンチル基、3-(3,3-ジメチルブトキシカルボニル) ペンチル基、3-(1-メチル 1 エチルプロポキシカルボニル)ペンチル 基、3-(1-エチル-2-メチルプロポキシカルボニ ル)ペンチル基、3-(1,1,2-トリメチルプロボ キシカルボニル)ペンチル基、3-(1,2,2-トリ メチルプロボキシカルボニル) ペンチル基、3-シクロ ヘキシルオキシカルボニルペンチル基、4-メトキシカ ルボニルペンチル基、4-エトキシカルボニルペンチル 基、4-プロポキシカルボニルペンチル基、4-シクロ プロポキシカルボニルペンチル基、4-イソプロポキシ カルボニルペンチル基、4-ブトキシカルボニルペンチ ル基、4-イソブトキシカルボニルペンチル基、4-se cーブトキシカルボニルペンチル基、4-tert-ブトキ シカルボニルペンチル基、4-シクロブトキシカルボニ ルペンチル基、1-ペンチルオキシカルボニルペンチル 基、4-(1-メチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、4-(2-メチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、4-イソペンチルオキシカルボニルペンチル基、4 -tert-ペンチルオキシカルボニルベンチル基、4-(1, 2-ジメチルプロポキシカルボニル)ペンチル 基、4-ネオペンチルオキシカルボニルペンチル基、4 - (1-エチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、4 -シクロペンチルオキシカルボニルペンチル基、4-ヘ キシルオキシカルボニルペンチル基、4-(1-メチル ペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、4-(2-メ チルペンチルオキシカルボニル) ペンチル基、4-(3 -メチルペンチルオキシカルボニル) ペンチル基、4-イソヘキシルオキシカルボニルペンチル基、4-(1-エチルブトキシカルボニル)ペンチル基、4 (2 エ チルブトキシカルボニル)ペンチル基、4-(1,1-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル基、4-(1, 2-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル基、4-(1,3-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル基、 4-(2, 2-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、4-(2,3-ジメチルブトキシカルボニル)ペン チル基、4-(3,3-ジメチルブトキシカルボニル) ペンチル基、4-(1-メチル-1-エチルプロポキシ カルボニル)ペンチル基、4-(1-エチル-2-メチ ルプロポキシカルボニル)ペンチル基、4-(1,1, 2-トリメチルプロボキシカルボニル)ペンチル基、4 - (1, 2, 2-トリメチルプロポキシカルボニル)ペ ンチル基、4-シクロヘキシルオキシカルボニルペンチ ル基、5-メトキシカルボニルペンチル基、5-エトキ シカルボニルペンチル基、5ープロボキシカルボニルペ ンチル基、うシクロプロボキシカルボニルペンチル 基、5-イソプロポキシカルボニルペンチル基、5-ブ トキシカルボニルペンチル基、5-イソブトキシカルボ ニルペンチル基、5-sec-ブトキシカルボニルペンチ ル基、5-tert-ブトキシカルボニルペンチル基、5-シクロブトキシカルボニルペンチル基、5-ペンチルオ キシカルボニルペンチル基、

【0049】5 (1 メチルブトキシカルボニル)ペンチル基、5-(2-メチルブトキシカルボニル)ペンチル基、5-イソペンチルオキシカルボニルペンチル基、5-tert-ペンチルオキシカルボニルペンチル基、5-(1,2-ジメチルプロボキシカルボニル)ペンチル基、5-ネオペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、5-(1-エチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、5-(1-エチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、

5-シクロペンチルオキシカルボニルペンチル基、5-ヘキシルオキシカルボニルペンチル基、5-(1-メチ ルペンチルオキシカルボニル) ペンチル基、5-(2-メチルペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、5-(3-メチルペンチルオキシカルボニル)ペンチル基、 5-イソヘキシルオキシカルボニルペンチル基、5-(1-エチルブトキシカルボニル)ペンチル基、5-(2-エチルブトキシカルボニル)ペンチル基、5-(1, 1-iii メチルブトキシカルボニル)ペンチル基、5-(1,2-ジメチルブトキシカルボニル)ペンチル 基、5-(1,3-ジメチルブトキシカルボニル)ペン チル基、5-(2,2-ジメチルブトキシカルボニル) ペンチル基、5-(2,3-ジメチルブトキシカルボニ ル)ペンチル基、5-(3,3-ジメチルブトキシカル ボニル)ペンチル基、5-(1-メチル-1-エチルプ ロポキシカルボニル)ペンチル基、5-(1-エチルー 2-メチルプロポキシカルボニル)ペンチル基、5-**(1.1.2-トリメチルプロポキシカルボニル)ペン** チル基、5-(1,2,2-トリメチルプロポキシカル ボニル) ペンチル基、5ーシクロヘキシルオキシカルボ ニルペンチル基等が挙げられる。

【0050】「含窒素飽和複素環式基」とは、環系を構成する窒素原子を1個以上含む5~7員環の飽和の複素環式基を意味し、ピロリジニル基、イミダゾリジニル基、ピラゾリジニル基、オキサゾリジニル基、チアゾリジニル基、イソオキサゾリジニル基、イソチアゾリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基等の窒素原子を1又は2個及び酸素原子又は硫黄原子を0又は1個有する5~6員環の飽和複素環式基が好ましい。

【0051】「含窒素不飽和複素環式基」とは、環系を構成する窒素原子を1個以上含む5~7員環の不飽和の複素環式基を意味し、ピロリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、ピリジル基、ジヒドロピリジル基、テトラヒドロピリジル基等の窒素原了を1~4個及び酸素原了又は硫黄原子を0又は1個有する5~6員環の不飽和の複素環式基が好ましい。

【0052】本発明化合物(I)及び該化合物の製造中間体(II)は常法に従って塩への変換を行うことができる。本発明化合物及び該化合物の製造中間体の塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩等の無機酸との酸付加塩、あるいは酢酸塩、シュウ酸塩、マロン酸塩、コハク酸塩、ヒベンズ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、乳酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩等の有機酸との酸付加塩が挙げられる

【0053】本発明には、本発明化合物(I)及び該化

合物の製造中間体(II)の水和物等の各種の溶媒和物も含まれる。

[0054]

【発明の実施の形態】本発明化合物(I)及び該化合物の製造中間体(II)は、その基本骨格や基の特徴を考慮して種々の合成法を適用して製造することが可能であり、以下にその代表的な製造法(A及びB)を示す。こ

こで、製造法A及び製造法Bのいずれの製法及びそれら に準ずる製法を用いても本発明化合物を製造することが できる。

【0055】製造法A 【0056】 【化9】

【0057】(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、m、n、V、X、Y、Zは前記と同意義を示し、Tは R_9 NH~Xはヒドロキシ基を示し、Uはハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基を示し、 R_9 は水素原子又は低級アルキル基を示す。)以下、各工程毎に説明する。【0058】工程A1

式(III)で表される化合物と式(IV)で表される化合 物を反応させることにより置換ベンズアミド誘導体 (1 1)を製造することができる。反応は塩基、例えば炭酸 カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水 素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、水酸化カリウ ム、水酸化ナトリウム、水酸化リチウム等のアルカリ金 **属水酸化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチル** アミン等のアルキルアミン類、ピリジン、ルチジン、4 ージメチルアミノピリジン等のピリジン類の存在下、あ るいは塩基の非存在下で、アセトニトリル、N. N-ジ メチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の非プロ トン性極性溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、1,2 - ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、エーテル、テト ラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、トル エン等のベンゼン系溶媒等、反応に影響を及ぼさない溶 媒中、又は無溶媒中で行う。反応は通常、室温乃至加温 下で行うことができる。化合物(III)のUがヒドロキ シ基の場合、ジシクロヘキシルカルボジイミドやカルボ ニルジイミダゾール等の縮合剤を用いるか、又はUを常 法によりp-ニトロフェノキシ基、ハロゲン原子等、反 応性の高い置換基に変換したのち本反応を行うことができる。

【0059】なお、置換ベンズアミド誘導体(II)又は 本発明化合物(I)の R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかがハロ ゲン原子が置換していてもよい低級アルキルカルボニル 基等のアシル基である場合には、化合物 (III) のアシ ル基を保護してから本反応を行い、本反応後又は工程A 2における反応後脱保護を行って製造することが好まし い。また、置換ベンズアミド誘導体(11)又は本発明化 合物(I)の R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかがアミノ基、モ ノ低級アルキルアミノ基、モノ若しくはジー低級アルキ ルアミノアルキルアミノ基、1-ウレイド基である場合 には、化合物(III)のアミノ基部分を保護してから木 反応を行い、本反応後又は工程A2における反応後脱保 護を行って製造するか、あるいはニトロ基を有する化合 物(III)を用いて本反応を行い、本反応後又は工程A 2における反応後還元反応を行いニトロ基をアミノ基に 変換して製造することができる。さらに、置換ベンズア ミド誘導体(II)又は本発明化合物(I)のR₁、R₂、 R₃のいずれかがヒドロキシ基である場合には、化合物 (III) においてヒドロキシ基を有する化合物を使用せ ず、アルコキシ基を有する化合物(III)を使用するこ ともできる。この化合物を用いた場合は、本反応後又は 工程A2における反応後、ビリジン塩酸塩、三臭化ホウ 素、臭化水素酸酢酸溶液、接触還元等を用いた脱アルキ ル化反応により、アルコキシ基をヒドロキシ基に変換し て製造することができる。さらにまた、置換ベンズアミ ド誘導体(II)又は本発明化合物(I)のR₁、R₂、R aのいずれかが低級アルキルカルボニルオキシ基である 場合には、上記で得られたR1、R2、R3のいずれかが ヒドロキシ基である置換ベンズアミド誘導体(II) 又は 本発明化合物(I)にカルボン酸又はその反応性誘導体 を作用させることにより製造することができる。さらに また、置換ベンズアミド誘導体(II)又は本発明化合物 (I) の R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかがハロゲン原子、Eドロキシ基、ニトロ基である場合には、アミノ基を有す る化合物(III)に亜硝酸塩と強酸を作用させジアゾニ ウム塩とし、このジアゾニウム塩の置換反応により各種 置換基へ変換することもできる (サンドマイヤー法、ガ ッターマン反応、シーマン反応)。この操作は、本反応 後又は工程A2における反応後に行うことができる。 【0060】工程A2

工程 A 1 で得られた置換ベンズアミド誘導体(II)と化合物(V)を反応させることにより、また必要に応じてさらにNー置換反応を行うことにより、本発明化合物(I)を得ることができる。反応は、工程 A 1 と同様にして行われる。置換ベンズアミド誘導体(II)のVがヒドロキシ基の場合、ジシクロヘキシルカルボジイミドやカルボニルジイミダゾール等の縮合剤を用いるか、又はVを常法によりpーニトロフェノキシ基、ハロゲン原子等、反応性の高い置換基へ変換したのち本反応を行うこともできる。

【0061】本発明化合物(I)にさらにN-置換反応 又はO-置換反応を行うことにより別の本発明化合物 (I)に導くことができる。N-置換反応としては、モ

 R_{4} \sim (CH₂) m-X- \sim

ノアルキル化、ジアルキル化、アミド化等公知の方法が あげられ、例えばギ酸、水素化ホウ素化合物等の還元剤 とホルムアルデヒド、アセトアルデヒド、グリオキサー ル等のアルデヒド、無水酢酸等の酸無水物を併用する反 応、カルボン酸若しくはその反応性誘導体を用いる反 応、アルキルハライドを用いる反応、低級アルコキシ 基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基若 しくは低級アルキルスルフィニル基等の脱離基又はハロ ゲン原子を有する化合物を用いる反応、アルデヒド、ケ トンを作用させてイミン体とした後、水素化ホウ素化合 物等を用いる還元反応もしくはパラジウム炭素等を触媒 として用いる水素添加反応、又はこれらの反応の組み合 わせにより適宜行うことができる。なお、アルキルハラ イドを用いるN-置換反応において、フタルイミド基が 置換しているアルキルハライドを使用した場合には、メ チルアミン等の塩基によりフタルイミド基をアミノ基に 変換した後 (ガブリエル法)、このアミノ基に対してさ らにNー置換反応を行うことが可能である。Oー置換反 応としては、アルキル化、アシル化等の公知の方法が挙 げられ、カルボン酸若しくはその反応性誘導体を用いる 反応、アルキルハライドを用いる反応、又はこれらの反 応の組み合わせにより適宜行うことができる。

【0062】なお、化合物(III)、(IV)及び(V)は、市販のものを用いるほか、必要に応じて前記N-置換反応又はOー置換反応を組み合わせることにより製造することができる。

【0063】製造法B

[0064]

【化10】

$$R_4$$
— N — (CH_2) m — X — C — Y — (CH_2) m — Z
 R_2
 R_3
 R_3

【0065】(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、m、n、 T、U、V、X、Y、Zは前記と同意義を示す。) 【0066】工程B1

化合物(VI)は化合物(IV)と化合物(V)を反応させることにより製造することができる。反応は工程A2と同様にして行う。

【0067】工程B2·

工程B1で得られた化合物(VI)と化合物(III)を反 応させることにより本発明化合物(丁)へ導くことがで きる。反応は、工程A1と同様にして行う。なお、本発 明化合物(I)のR₁、R₂、R₃のいずれかがハロゲン 原子が置換していてもよい低級アルキルカルボニル基等 のアシル基である場合には、化合物(111)のアシル基 を保護してから本反応を行い、本反応後脱保護を行って 製造することが好ましい。また、本発明化合物(I)の R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかがアミノ基、モノ低級アルキ ルアミノ基、モノ若しくはジー低級アルキルアミノアル キルアミノ基、1-ウレイド基である場合には、化合物 (III)のアミノ基部分を保護してから本反応を行い、 本反応後脱保護を行って製造するか、あるいはニトロ基 を有する化合物(III)を用いて本反応を行い、本反応 後還元反応を行いニトロ基をアミノ基に変換して製造す ることができる。さらに、本発明化合物(T)のR、 R₂、R₃のいずれかがヒドロキシ基である場合には、化 合物(III)においてヒドロキシ基を有する化合物を使 用せず、アルコキシ基を有する化合物(111)を使用す ることもできる。この化合物を用いた場合は、本反応 後、ピリジン塩酸塩、三臭化ホウ素、臭化水素酸酢酸溶 液、接触還元等を用いた脱アルキル化反応により、アル コキシ基をヒドロキシ基に変換して製造することができ る。さらにまた、本発明化合物(I)の R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかが低級アルキルカルボニルオキシ基である場 合には、上記で得られた R_1 、 R_2 、 R_3 のいずれかがし ドロキシ基である本発明化合物(I)にカルボン酸又は その反応性誘導体を作用させることにより製造すること ができる。さらにまた、木発明化合物(I)のR、 R₂、R₃のいずれかがハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニ トロ基である場合には、アミノ基を有する化合物 (11 1) に亜硝酸塩と強酸を作用させジアゾニウム塩とし、 このジアゾニウム塩の置換反応により各種置換基へ変換 することもできる(サンドマイヤー法、ガッターマン反 応、シーマン反応)。この操作は、本反応後に行うこと ができる。

【0068】本発明化合物(I)にさらにN一置換反応 又はO一置換反応を行うことにより別の本発明化合物 (I)に導くことができる。N一置換反応としては、モ ノアルキル化、ジアルキル化、アミド化等公知の方法が あげられ、例えばギ酸、水素化ホウ素化合物等の還元剤 とホルムアルデヒド、アセトアルデヒド、グリオキサー ル等のアルデヒド、無水酢酸等の酸無水物を併用する反 応、カルボン酸若しくはその反応性誘導体を用いる反 応、アルキルハライドを用いる反応、低級アルコキシ 基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基若 しくは低級アルキルスルフィニル基等の脱離基メはハロ ゲン原子を有する化合物を用いる反応、アルデヒド、ケ トンを作用させてイミン体とした後、水素化ホウ素化合 物等を用いる還元反応もしくはパラジウム炭素等を触媒として用いる水素添加反応、又はこれらの反応の組み合わせにより適宜行うことができる。なお、アルキルハライドを用いるNー置換反応において、フタルイミド基が置換しているアルキルハライドを使用した場合には、メチルアミン等の塩基によりフタルイミド基をアミノ基に変換した後(ガブリエル法)、このアミノ基に対してさらにNー置換反応を行うことが可能である。〇一置換反応としては、アルキル化、アシル化等の公知の方法が挙げられ、カルボン酸若しくはその反応性誘導体を用いる反応、アルキルハライドを用いる反応、又はこれらの反応の組み合わせにより適宜行うことができる。

【0069】なお、化合物(III)、(IV)及び(V)は、市販のものを用いるほか、必要に応じて前記N-置換反応又はO-置換反応を組み合わせることにより製造することができる。

【0070】上記製造法A、製造法Bいずれの製法又はこれらに準ずる製法を用いて得られた本発明化合物(I)は常法により、各種塩とすることができる。

【0071】かくして得られた本発明化合物(I)は、後述のごとく優れた消化管運動改善作用を有し、かつ安全性も高いので、上腹部不定愁訴、悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、腹痛、腹部膨満感、慢性胃炎、逆流性食道炎、胃切除後症候群等の各種消化管運動障害の予防・治療等に有用である。

【0072】本発明化合物(「)は製薬上許容される補 助剤を配合して、経口投与用あるいは非経口投与用製剤 とすることができる。経口投与用の製剤としては、本発 明化合物(I)を適当な添加剤たとえば乳糖、マンニッ ト、トウモロコシデンプン、結晶セルロース等の賦形 剤、セルロース誘導体、アラビアゴム、ゼラチン等の結 合剤、カルボキシメチルセルロースカルシウム等の崩壊 剤、タルク、ステアリン酸マグネシウム等の滑沢剤など を適宜使用することにより錠剤、散剤、顆粒剤、カプセ ル剤とすることができる。また、これらの固形製剤をヒ ドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロ キシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネー ト、セルロースアセテートフタレート、メタアクリレー トコーポリマーなどの被覆用基剤を用いて腸溶性製剤と することができる。非経口投与用の製剤としては、たと えば水、エタノール、グリセリン、慣用な界面活性剤等 を組み合わせることにより注射用液剤に、また坐剤用基 剤を用いて坐剤とすることができる。

【0073】本発明化合物(I)の投与量は年齢、体重、症状、治療効果、投与方法、投与期間により異なるが、通常、経口投与の場合には0.1~2000mg/日、好ましくは1~300mg/日の投与範囲で1日1~3回に分けて投与する。

[0074]

【作用】

胃腸管運動亢進作用

雄性イヌ (体重9~10kg) の胃幽門前庭部及び十二指腸 にフォーストランスデューサー (F-121S;スターメディカル製) を慢性的に縫着した (Itoh Z.et al.,Am.J.Di g.Dis. 22,117~124,1977)。 給餌 (30g/kg,Gaines me al;味の素ゼネラルフーズ製) の2時間後の食後期において試験を行った。各トランスデューサーから得られる収縮信号を増幅 (RTA-1200;日本光電製) し、レコーダ

ーならびにコンピューター上に記録した。幽門前庭部における収縮波と収縮基線とによって得られる面積を解析プログラム (DSSFFT, V.21;日本光電製)により積分し、運動係数を算出した。被験薬剤は生理食塩水に溶解し、静脈内投与した。結果は下式により計算し、運動係数率として表1に示した。

[0075]

【数1】

運動係数率(光)= 蒸剤投与後10分間の運動係数

※剤投与前10分間の運動係数 ×100

【0076】 【表1】

表 1

被験化合物	投与量 (mg/kg)	運動係数率 (%)
実施例 2の化合物	0.5	269.3
奥施例 8の化合物	1.	141.4
実施例20の化合物	1	181.0
実施例22の化合物	1	175.3

【0077】毒性試験

4~5週令のICR系マウスを1群3匹として用いた。

各実施例化合物を5%アラビアゴム液に懸濁した後、それぞれ500mg/kgを経口投与して1週間観察したところいずれの投与群においても死亡例は認められなかった。 【0078】

【実施例】以下、実施例により本発明をさらに具体的に 説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0079】実施例1

 $2-\lfloor N-(3,4-i)$ メトキシベンゾイル) アミノメチル] -4-[[2-[(2-i)ダゾリジニデン) イミノ] エチル] アミノカルボニル] 1,3 チアゾール・塩酸塩

[0080]

【化11】

【0081】工程1

2-フタルイミドメチルー4-[(2-tert-ブトキシカルボニルアミノエチル)アミノカルボニル]-1,3-チアゾールの製造

【0082】特開昭57-91980号公報の方法に従 って製造した2-フタルイミドメチルー4-ヒドロキシ カルボニル 1,3 チアゾール21.5gに乾燥した 1.2-ジクロロエタン350ml、オキザリルクロリド 66ml及びN, Nージメチルホルムアミド1. Omlを加 え、80℃で8時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残 留物にトルエンを加え溶媒を減圧留去した後、残さを乾 燥した1,2ージクロロエタン350mlに溶解した。こ の溶液に、氷冷下で、N-tert-ブトキシカルボニルエ チレンジアミン12.1gをクロロホルム100mlに溶 解した液を滴下し、続いてトリエチルアミン10.5ml を加え5分間攪拌した。この反応液を飽和硫酸水素カリ ウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、無 水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去し た。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフ ィー(クロロホルム:メタノール=30:1)で精製し て、褐色油状物の標記化合物32.0gを得た。収率1 00%。

H = NMR (CDCl₂) $\delta : 1.42(9H, s), 3.34(2H, q), 3.53$ (2H, q), 5.00(1H, brs), 5.15(2H, s), 7.50(1H, brs), 7.75~7.87(2H, m), 7.90~7.96(2H, m), 8.05(1H, s)

MS (FAB) m/z : 431 (MH⁻)

【0083】工程2

2-[N-(3,4-ジメトキシベンゾイル) アミノメチル]-4-[2-(tert-ブトキシカルボニルアミノエチル) アミノカルボニル]-1,3-チアゾールの製造

【0084】2-フタルイミドメチルー4-【(2-te rt-ブトキシカルボニルアミノエチル)アミノカルボニル 1,3 チアゾール34.4 gを30%メチルアミン-エタノール溶液250mlに溶解し、室温で10時間攪拌した後、反応液を減圧濃縮した。残留物に塩化メチレン500mlを加え、析出晶を沪去した。沪液を飽和炭酸カリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残さを乾燥した塩化メチレン350mlに溶解し、氷冷下で

トリエチルアミン15ml及び3.4ージメトキシベンゾイルクロリド15.0gを加え同温で2時間攪拌した。この反応液を飽和硫酸水素カリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製して、油状物の標記化合物21.6gを得た。収率62.4%。

: H - NMR (CDCl₃) δ : 1.40(9H,s),3.3 $\tilde{\tau}$ ~3.48(2H, m),3.50~3.60(2H,m),3.93(3H,s),3.94(3H,s),4.86(2H, d),5.15(1H,brs),6.91(1H,d),7.40~7.60(3H,m),7.75(1H,t),7.87(1H,brs)

MS (FAB) m/z: 465 (MH⁻)

【0085】工程3

2-[N-(3,4-ジメトキシベンゾイル) アミノメチル]-4-[2-[(2-イミダゾリジニデン) イミノ] エチル] アミノカルボニル]-1,3-チアゾール・塩酸塩の製造

【0086】2-[N-(3,4-ジメトキシベンゾイ ル) アミノメチル] -4- [[2-(tert-ブトキシカ ルボニルアミノ) エチル] アミノカルボニル] -1,3 チアゾール21.6gをエタノール80mlに溶解し、 4N塩酸-ジオキサン溶液80mlを加え、1時間攪拌し た。析出した結晶を沪取した後減圧乾燥し、この結晶を 乾燥したメタノール240㎖に溶解し、2-メチルチオ イミダゾール6.26g及び28%ナトリウムメトキシ ドーメタノール溶液8.7gを加え、2日間加熱環流し た。反応液をセライト沪過し、沪液を減圧濃縮した後、 残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (NHシ リカゲルDM-1020(富士シリシア社製)、クロロホル ム:メタノール=10:1)で精製して、2-「N-(3, 4-i) (3, 4-i) (3, 4-i) (3, 4-i) (3, 4-i) (3, 4-i)**-[[2-[(2-4ミダゾリジニデン)イミノ]エチ** $[\mu]$ アミノカルボニル[-1, 3-4アゾールを得た。 これに4N塩酸ージオキサン溶液を加え塩酸塩とするこ とにより、アモルファスの標記化合物8.05gを得 た。収率38.2%。

MS (FAB) m/z: 433 (MI))

IR (KBr) cm⁻¹: 3250,2900,1680,1650

-H - NMR (DMSO-d₆) δ : 3.05~3.50(5H, m), 3.57(4H, s), 3.81(3H, s), 3.82(3H, s), 4.75(2H, d), 7.05(2H, d), 7.52~7.58(2H, m), 8.16(1H, s), 8.31(1H, s), 8.50(1H, br s), 9.45(1H, brs)

【0087】実施例2

2 [N (2, 4, 5 トリメトキシベンゾイル) ア ミノ] -5- [(2-ジイソプロビルアミノエチル) ア ミノカルボニル] フラン

[0088]

【化12】

【0089】工程1

2-[N-(2, 4, 5-トリメトキシベンゾイル)アミノ]-5-(エトキシカルボニル)フランの製造【0090】2-アミノ-5-(エトキシカルボニル)フラン9gの乾燥した塩化メチレン100ml溶液に、氷冷下でトリエチルアミン6.07g、4-ジメチルアミノピリジン122mg及び2,4,5-トリメトキシベンゾイルクロリド13.4gを順次加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(NHシリカゲルDM-1020(富士シリシア社製)、クロロホルム)で精製して、標記化合物11.7gを得た。収率61%。

融点:212~214℃

MS (FAB) m/z : 350 (MH⁻)

- II NMR (CDCl₃) δ: 1.38(3II, t), 3.92(3II, s), 3.98 (3H, s), 4.08(3H, s), 4.36(2H, q), 6.57(1H, s), 6.68(1H, d), 7.23(1H, d), 7.75(1H, s), 10.42(1H, s)

【0091】工程2

I R (KBr) cm^{-1} : 3316, 1728, 1655, 1613, 1543, 1534. 152 σ

II NMR (DMSO-d₆) δ : 3.76(3II,s),3.89(3II,s),3.99(3H,s),6.50(1H,d),6.81(1H,s),7.25(1H,d),7.37(1H,s),10.78(1H,s),12.77(1H,brs)

【0093】T程3

2-[N-(2,4,5-)] トキシベンゾイル) アミノ]-5-[(2-) ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] フラン

【0094】2 [N (2,4,5 トリメトキシベンゾイル)アミノ]-5-(ヒドロキシカルボニル)フラン1.9gの乾燥したN,N-ジメチルホルムアミド50ml懸濁液に、1,1'-カルボニルジイミダゾール1.16gを加え、30分間撹拌した。次いでこの液にN,N-ジイソプロピルエチレンジアミン1.13gを加え、100℃で30分間撹拌した。反応液に氷水を加

え、塩化メチレンで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=7.5:1)で特製して、標記化合物1.19gを得た。

ラニエグで研究して、標記化合物1.19

融点:134~135℃

MS (FAB) m/z: 448 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3368,2967,1667,1655,1613

 $H = NMR (CDCl_3) \delta : 1.07(12H,d), 2.68(2H,t), 3.0$ 8(2H,q), 3.38(2H,q), 3.92(3H,s), 3.98(3H,s), 4.06(3H, s),6.57(1H,s),6.60(1H,d),6.84(1H,brs),7.07(1H,d),7.76(1H,s),10.32(1H,s)

【0095】実施例3

2-[N-(4,5-ジメトキシ-2-ヒドロキシベン ゾイル) アミノ]-5-[(2-ジイソプロピルアミノ エチル) アミノカルボニル] フラン・マレイン酸塩

[0096]

【化13】

【0097】工程1

2-[N-(4,5-ジメトキシ-2-ヒドロキシベン ゾイル)アミノ]-5-(エトキシカルボニル)フラン の製造

【0098】実施例2の工程1で得た2-LN-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル)アミノ]-5-(エトキシカルボニル)フラン4.01gにシアン化カリウム3.20g及び乾燥したN,N-ジメチルホルムアミド30mlを加え、アルゴン雰囲気下、130℃で14時間攪拌した。反応液を水100ml中に注ぎ、硫酸水素カリウム6.5gを加え攪拌し、析出する結晶を沪取した。この結晶を水及びエタノールで順次洗浄し、減圧乾燥することにより、褐色粉末の標記化合物2.26gを得た。収率58.9%。

融点:177~180℃

IR (KBr) cm⁻¹: 1711,1693,1647

 $-H = NMR \text{ (DMSO-d}_6 \text{) } \delta : 1.29(3H,t),3.77(3H,s),3.$ 81(3H,s),4.28(2H,q),6.53~6.58(2H,m),7.33~7.36(1H,m),7.59(1H,s),11.60(1H,s),11.98(1H,s)

【0099】工程2

2-[N-(4,5-ジメトキシ-2-ヒドロキシベン ゾイル)アミノ]-5-[(2-ジイソプロピルアミノ エチル)アミノカルボニル]フラン・マレイン酸塩の製造

【0100】2-[N-(4,5-ジメトキシ-2-ヒ ドロキシベンゾイル)アミノ]-5-(エトキシカルボ ニル)フラン2.10gにN,N-ジイソプロピルエチ レンジアミン4.76gを加え、130℃で1時間攪拌した。反応液を水200ml中に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=10:1)で精製して、褐色固体の2-[N-(4,5 ジメトキシ 2 ヒドロキシベンゾイル)アミノ] 5-[(2-ジイソプロビルアミノエチル)アミノカルボニル]フラン1.47gを得た。これをクロロホルム30mlに溶解し、マレイン酸0.183gを加え攪拌し、溶媒を減圧留去した。残さをエーテルで洗浄し、減圧乾燥することにより、褐色粉末の標記化合物0.723gを得た。

融点:177~179℃

MS (FAB) m/z:434 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 1671, 1636

 $\begin{array}{l} {}^{1}\text{H}-\text{NMR} \ (\text{DMSO-d}_{6}\) \ \delta : 0.99\sim 1.09 (12\text{H},\text{m})\,, 2.20\sim \\ {}^{2}\text{.48(2\text{H},\text{m})}\,, 2.63\sim 2.80 (2\text{H},\text{m})\,, 2.99\sim 3.24 (2\text{H},\text{m})\,, 3.28\\ \sim & 3.55 (2\text{H},\text{m})\,, 3.71 (3\text{H},\text{s})\,, 3.77 (3\text{H},\text{s})\,, 6.23 (2\text{H},\text{s})\,, 6.53\\ \sim & 6.58 (2\text{H},\text{m})\,, 7.35 (1\text{H},\text{s})\,, 7.59 (1\text{H},\text{s})\,, 7.61\sim 7.67 (1\text{H},\text{m})\,, 8.17\sim 8.23 (1\text{H},\text{m})\,, 13.04\sim 13.09 (1\text{H},\text{m}) \end{array}$

【0101】実施例4

2 [N (2,4,5 トリメトキシベンゾイル)ア ミノ]-5-[(2-ジメチルアミノエチル)アミノカ ルボニル] ピリジン・マレイン酸塩

[0102]

【化14】

【0103】工程1

2-[N-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル)ア ミノ]-5-(エトキシカルボニル)ピリジンの製造 【0104】2-アミノ-5-(エトキシカルボニル) ピリジン3.72gを乾燥した1,2-ジクロロエタン100mlに溶解し、これに2,4,6-トリメトキシベンゾイルクロリド5.44gを加え、15時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、飽和重曹水を加え、ク

ロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次 洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧 留去した。残留物をイソプロピルエーテルとエタノール の混合溶媒より再結晶して、標記化合物6.93gを得 た。収率86%。

-H-NMR(CDC1₃) δ :1.41(3H,t),3.94(3H,s),3.98(3H,s),4.10(3H,s),4.39(2H,q),6.58(1H,s),7.78(1H,s),8.32(1H,dd),8.48(1H,dd),8.95(1H,dd),10.61(1H,s)【0105】工程2

2-[N-(2, 4, 5-トリメトキシベンゾイル) ア ミノ] -5-[(2-ジメチルアミノエチル) アミノカ ルボニル] ピリジン・マレイン酸塩の製造

【0106】N, N-ジメチルエチレンジアミン514 mgを乾燥したトルエン10mlに溶解し、氷冷下で2.0 Mトリメチルアルミニウムートルエン溶液2.9mlを少 しずつ滴下し、室温で1時間撹拌した。この液に2-**丿**] -5-(エトキシカルボニル)ピリジン1.0gを 加え、内温80℃で2時間攪拌した。反応液を冷却し、 飽和重曹水中に注ぎ、クロロホルムを加えて攪拌した 後、セライト沪過した。沪液を分液し、有機層を水、飽 和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した 後、溶媒を減圧留去した。残留物をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー (NHシリカゲルDM-1020 (富士シリ シア社製)、クロロホルム: n-ヘキサン=2:1)で 精製して、2-[N-(2,4,5-トリメトキシベン ゾイル) アミノ] -5-[(2-ジメチルアミノエチ ル) アミノカルボニル] ピリジン? 70 mgを得た。収率

: H-NMR (CDC1₃) δ : 2.28(6H,s),2.53(2H,t),3.53 (2H,q),3.94(3H,s),3.98(3H,s),4.10(3H,s),6.58(1H,s),6.88(1H,brs),7.78(1H,s),8.11(1H,dd),8.47(1H,dd),8.78(1H,dd),10.57(1H,s)

得られた2- 「N-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル)アミノ」-5- L(2-ジメチルアミノエチル)アミノカルボニル]ピリジン770嘅をエタノール20 mlに溶解し、マレイン酸222嘅を加え加熱溶解した。この溶液を冷却し析出晶を沪取し、この結晶をエタノールと水の混合溶媒で再結晶して、標記化合物890嘅を得た。

融点:218~220℃

MS (FAB) m/z : 403 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3331,1655,1608,1352,1275

- II NMR (DMSO-d₆) δ : 2.85(6H,s),3.26(2H,t),3.62(2H,q),3.78(3H,s),3.92(3H,s),4.07(3H,s),6.02(2H,s),6.88(1H,s),7.54(1H,s),8.27(1H,dd),8.37(1H,d),8.7(1H,t),8.81(1H,d),9.30(2H,brs),10.60(1H,s)

【0107】実施例5

2-[N-(3-シアノベンゾイル) アミノ] -5-[(2-ジイソプロピルアミノ) エトキシカルボニル] フラン

[0108]

【化15】

$$\begin{array}{c|c} & & & & \\ & &$$

【0109】工程1

2 - [N- (3-シアノベンゾイル) アミノ] -5-(エトキシカルボニル) フランの製造

【0110】実施例2の工程1において、2,4,5-トリメトキシベンゾイルクロリドの代わりに3-シアノ ベンゾイルクロリドを用いて同様の操作を行い、標記化 合物を得た。

 \cdot H - NMR (CDCl₃) δ : 1.34(3H,t),4.33(2H,q),6.71 (1H,d),7.24(1H,d),7.66(1H.t),7.85 \sim 7.90(1H,m),8.13 \sim 8.18(1H,m),8.29 \sim 8.31(1H,m)

【0111】工程2

2- LN- (3-シアノベンゾイル) アミノ」-5-(ヒドロキシカルボニル) フランの製造

【0112】2 [N (3 シアノベンゾイル)アミノー5ー(エトキシカルボニル)フラン105mgに乾燥した塩化メチレン2mlを加え、氷冷下で1.0M三臭化ホウ素ー塩化メチレン溶液1.6mlを滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液に氷冷下で水10mlを加え、析出した結晶を沪取し、この結晶を水、エーテルで順次洗浄した後、減圧乾燥することにより、褐色固体の標記化合物81mgを得た。収率81%。

- H - NMR (DMSO-d₆) δ : 6.59~6.60(1H, m),7.27~7.28(1H, m),7.72~7.78(1H, m),8.06~8.10(1H, m),8.47 (1H, s),12.08(1H, s),12.40~13.00(1H, br)

IR (KBr) cm⁻¹: 2361,1706

【0113】工程3

2- [N-(3-シアノベンゾイル) アミノ] -5-[[2-(ジイソプロビルアミノ) エトキシ] カルボニル「フランの製造

【0114】2 [N (3 シアノベンゾイル)アミノーラー(ヒドロキシカルボニル)フラン27gを乾燥したN,Nージメチルホルムアミド2mlに溶解し、1,1'ーカルボニルジイミダゾール17gを加え、室温で30分間攪拌した。次いで2ージイソプロピルアミノエタノール15gを加え、室温で17時間攪拌した。反応液に水40ml及びクロロホルム50mlを加え分液し、有機層を水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去して、黄色油状物の標記化合物43gを得た。

MS (FAB) m/z:384 (MH-)

IR (neat) cm⁻¹: 2361,1697,1668

H - NMR (CDCl₃) $\delta : 0.97 \sim 1.05(12H, m), 2.67 \sim 2.76(2H, m), 2.96 \sim 3.06(2H, m), 4.19(2H, t), 6.70 \sim 6.72(1)$

H, m), $7.21 \sim 7.23$ (1H, m), $7.63 \sim 7.69$ (1H, m), $7.86 \sim 7.89$ (1H, m), $8.15 \sim 8.18$ (1H, m), 8.30 (1H, brs), $11.50 \sim 12.00$ (1H, m)

【0115】以下、実施例1~5と同様の操作を行い、 実施例6~27の化合物を製造した。

【0116】実施例6

2-[N-(2,4,5-h)] トリメトキシベンゾイル) アミノメチル] -4-[(2-i) イソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] -1, 3-f アゾール・マレイン酸塩

[0117]

【化16】

【0118】融点:148.6~150.1℃

 $MS(EI) m/z: 478(M^+)$

IR (KBr) cm⁻¹: 3343,2996,1707

H-NMR (DMSO-d₆) δ : 1.28(12H,d),3.05~3.72(6 H,m),3.73(3H,s),3.88(3H,s),3.96(3H,s),4.79(2H,d),6.02(2H,s),6.79(1H,s),7.44(1H,s),8.18(1H,s),8.53~8.68(3H,br),9.00(1H,t)

【0119】実施例7

 $2-[N-(2, 4, 5-F)] \times F = [N-(2, 4, 5-F)] \times$

[0120]

【化17】

【0121】融点:160~161℃

MS (FAB) m/z: 392 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3299,1676,1638,1607

- H - NMR (CDCl₃) δ : 2.29(6H,s),2.51(2H,t),3.51 (2H,q),3.92(3H,s),3.98(3H,s),4.09(3H,s),6.58(1H,s),6.61(1H,d),6.62(1H,s),7.11(1H,d),7.56(1H,s),10. 28(1H,s)

【0122】実施例8

[0123]

【化18】

$$\begin{array}{c} \text{MeO} \\ \text{MeO} \\ \text{DH} \\ \end{array} \begin{array}{c} \text{O} \\ \text{DH} \\ \text{O} \\ \end{array} \begin{array}{c} \text{H} \\ \text{O} \\ \text{O} \\ \text{O} \\ \end{array} \begin{array}{c} \text{Pr-i} \\ \text{Pr-i} \\ \end{array}$$

【0124】融点:179.5~180.7℃

MS (FAB) m/z : 448 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3302,2964,2831,1653,1640,1615,160

H = NMR (CDCl₃) δ : 0.99(12H,d),2.63(2H,t),3.0 0(2H,scpt),3.30(2H,q),3.80(3H,s),3.89(3H,s),4.61(2 H,d),6.20(1H,d),6.50(1H,s),6.73(1H,d),7.09(1H,t),7.20(1H,s),7.49(1H,s),12.50(1H,brs)

【0125】実施例9

2-[N-(4,5-ジメトキシ-2-ヒドロキシベン ゾイル) アミノ] <math>-4-[(2-ジイソプロビルアミノ エチル) アミノカルボニル] <math>-1, 3-オキサゾール・フマル酸塩

[0126]

【化19】

【0127】融点:80~90℃

MS (FAB) m/z : 435 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 1701,1671

- II NMR (DMSO-d₆) δ : 0.97~1.06(12H, m),2.23~2.50(2H, m),2.61~2.78(6H, m),3.09~3.28(4H, m),3.72 (3H, s),3.79(3H, s),6.54~6.61(3H, m),7.38(1H, s),8.16~8.29(1H, m),8.97~9.04(1H, m),10.46~10.68(2H, m)

【0128】実施例10

2-[N-(2,4,5-F)] トキシベンゾイル) アミノ] -5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] チオフェン・マレイン酸塩

[0129]

【化20】

$$\begin{array}{c|c} & 0 & \\ & C & \\ & & \\$$

【0130】融点:107~109℃ MS (FAB) m/z:464 (MH·)

IR (KBr) cm⁻¹: 3400,3350,1645,1608

 $\begin{array}{l} \text{-H-NMR (DMSO-d_6)} \ \delta: 1.29(12\text{H,d}), 3.18(3\text{H,br}), 3.42\sim3.60(2\text{H,m}), 3.60\sim3.80(2\text{H,m}), 3.77(3\text{H,s}), 3.89(3\text{H,s}), 3.97(3\text{H,s}), 6.02(2\text{H,s}), 6.81(1\text{H,s}), 7.38(1\text{H,s}), 7.80(1\text{H,d}), 7.99(1\text{H,d}), 8.60(1\text{H,brs}), 8.75(1\text{H,t}), 1.86(1\text{H,brs}), 1.86$

0.27(1H,s)

【0131】実施例11

2-[N-(2, 1, 5-hリメトキシベンゾイル) アミノ]-6-[(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] ピリジン・マレイン酸塩

[0132]

【化21】

$$\begin{array}{c|c} & 0 & 0 & 0 \\ \hline \end{array}$$

【0133】融点:175~176.5℃

MS (FAB) m/z : 459 (MH⁻)

IR (KBr) cm 1:3377,1672,1574,1350,1278

 $\begin{array}{l} - \,H - \,N\,M\,R \;\; (\,\text{DMSO-d}_6\,) \;\; \delta \;: 1.32(12\text{H,d})\,, 3.30(2\text{H,m})\,, \\ 3.45(2\text{H,m})\,, 3.66(2\text{H,m})\,, 3.79(3\text{H,s})\,, 3.93(3\text{H,s})\,, 4.15(3\text{H,s})\,, 6.02(2\text{H,s})\,, 6.90(1\text{H,s})\,, 7.59(1\text{H,s})\,, 7.80(1\text{H,dd})\,, \\ 8.06(1\text{H,t})\,, 8.46(1\text{H,dd})\,, 8.55(2\text{H,brs})\,, 8.93(1\text{H,brs})\,, 1 \end{array}$

0.51(1H,s)

【0134】実施例12

2-[N-(2,4,5-F)]リストキシベンゾイル)アミノ」-5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル)アミノカルボニル]ピリジン・マレイン酸塩

[0135]

【化22】

【0136】融点:185~187℃

MS (FAB) m/z: 459 (MH $^-$)

IR (KBr) cm⁻¹: 3331,1655,1608,1508,1311

 $\begin{array}{l} \text{-H-NMR} & \text{(DMSO-d}_6 \text{) } \delta : 1.30 \text{(12H,d)}, 3.20 \text{(2H,m)}, \\ 3.56 \text{(2H,m)}, 3.69 \text{(2H,m)}, 3.78 \text{(3H,s)}, 3.92 \text{(3H,s)}, 4.08 \text{(3H,s)}, 6.03 \text{(2H,s)}, 6.88 \text{(1H,s)}, 7.54 \text{(1H,s)}, 8.25 \text{(1H,dd)}, \\ 8.37 \text{(1H,d)}, 8.60 \text{(2H,brs)}, 8.79 \text{(1H,d)}, 8.85 \text{(1H,brs)}, 1. \end{array}$

0.60(1H,s)

【0137】実施例13

2-[N-(2,4,5-h)] トリメトキシベンゾイル) アミノ] -4-[(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] ピリジン・マレイン酸塩

[0138]

【化23】

【0139】融点:186~187℃

MS (FAB) m/z : 459 (MH)

IR (KBr) cm⁻¹: 3319,1667,1610,1363,1211

H = NMR (DMSO-d₆) δ : 1.31(12H,d),3.21(2H,m), 3.58(2H,m),3.69(2H,m),3.78(3H,s),3.92(3H,s),4.07(3

H,s),6.03(2H,s),6.88(1H,s),7.48(1H,dd),7.56(1H,s), 8.50(1H,d),8.60(2H,brs),8.68(1H,s),8.98(1H,t),10.5 6(1H,s)

【0140】実施例14

2-[N-(2,4,5-h)] トキシベンゾイル) アミノ] -6-[(2-i)メチルアミノエチル) アミノカルボニル] ピリジン・マレイン酸塩

[0141]

【化24】

【0142】融点:198~200℃

MS (FAB) m/z : 403 (MH⁻)

I.R. (KBr) cm^{-1} : 3308, 1668, 1354, 1271, 1209

- H - NMR (DMSO-d₆) δ : 2.86(6H,s),3.29(2H,t),3.68(2H,q),3.79(3H,s),3.93(3H,s),4.15(3H,s),6.02(2H,s),6.90(1H,s),7.59(1H,s),7.80(1H,dd),8.05(1H,t),8.46(1H,dd),8.90(1H,t),9.30(2H,brs),10.53(1H,s)

【0143】実施例15

2-[N-(2,4,5-hリメトキシベンゾイル) アミノ]-4-[(2-ジメチルアミノエチル) アミノカルボニル] ピリジン・マレイン酸塩

[0144]

【化25】

【0145】融点:148~149℃

MS (FAB) m/z: 403 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3321,1670,1419,1358,1282

- H - NMR (DMSO- d_6) δ : 2.85(6H,s),3.28(2H,t),3.63(2H,q),3.78(3H,s),3.92(3H,s),4.08(3H,s),6.02(2H,s),6.88(1H,s),7.50(1H,dd),7.57(1H,s),8.50(1H,d),8.69(1H,s),8.93(1H,t),9.30(2H,brs),10.55(1H,s)

【0146】実施例16

N-(2,4;5-トリメトキシベンゾイル)-2-[(2-ジメチルアミノエチル)アミノカルボニル]ア ニリン・マレイン酸塩

[0147]

【化26】

【0148】融点:169~170℃

MS (FAB) m/z: 402 (MH-)

IR (KBr) cm⁻¹: 3530, 3287, 2945, 2702, 1662, 1648, 160

 4 H - N M R (DMSO-d₆) δ : 2.84(6H,s),3.20~3.50(4 H,m),3.60~3.95(2H,m),3.76(3H,s),3.90(3H,s),4.06(3 H,s),6.02(2H,s),6.81(1H,s),7.18(1H,dt),7.47~7.55(1H,m),7.56(1H,s),7.70(1H,dd),8.65(1H,dd),8.77(1H,t),11.83(1H,s)

【0149】実施例17

N (2,4,5 トリメトキシベンゾイル) 3 [(2-ジメチルアミノエチル)アミノカルボニル]ア ニリン・ヒベンズ酸塩

[0150]

【化27】

【0151】融点:124~128℃(発泡)

MS (FAB) m/z : 402 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 1653,1609

- H – N M R (CDCl₃) δ : 2.46~2.51(8H, m), 2.92~2.9 6(2H, m), 3.54~3.57(2H, m), 3.84~4.02(9H, m), 6.54~6. 63(3II, m), 7.22~7.27(2II, m), 7.39~7.43(2II, m), 7.50~ 7.53(3H, m), 7.75~7.76(1H, m), 7.89~7.94(3H, m), 8.08 ~8.27(1H, m), 9.93(1H, s), 12.03~12.21(2H, m)

【0152】実施例18

N-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル)-4-[(2-ジメチルアミノエチル)アミノカルボニル]ア ニリン・マレイン酸塩

[0153]

【化28】

【0154】融点:185~186℃

MS (FAB) m/z : 402 (MH⁻)

【0155】実施例19

N-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル) -2- [(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル、アニリン・マレイン酸塩

[0156]

【化29】

$$\begin{array}{c|c} \text{MeO} & \begin{array}{c} 0 \\ \vdots \\ N \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ \vdots \\ N \end{array} \\ \begin{array}{c} C \\ 0 \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ N \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} Pr-i \\ Pr-i \end{array} \\ \begin{array}{c} C000H \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} C000H \\ \end{array} \\ \end{array}$$

【0157】融点:166.5~167.2℃

MS (FAB) m/z : 458 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3400,3250,2900,2650,1655

 $\begin{array}{l} \text{I} + \text{I} + \text{NMR. (DMSO-d_6)} \delta: 1.28 \sim 1.31 \, \text{(12H,m)} \, , 3.20 \sim \\ 3.75 \, \text{(7H,m)} \, , 3.76 \, \text{(3H,s)} \, , 3.90 \, \text{(3H,s)} \, , 4.06 \, \text{(3H,s)} \, , 6.03 \, \text{(2H,s)} \, , 6.81 \, \text{(1H,s)} \, , 7.15 \sim 7.21 \, \text{(1H,m)} \, , 7.49 \sim 7.56 \, \text{(2H,m)} \, , \\ 7.63 \sim 7.66 \, \text{(1H,m)} \, , 8.57 \sim 8.60 \, \text{(2H,m)} \, , 8.81 \, \text{(1H,t)} \, , 11.83 \, \text{(1H,s)} \end{array}$

【0158】実施例20

N-(2,4,5-トリメトキシベンゾイル)-3-[(2-ジイソプロピルアミノエチル)アミノカルボニル]アニリン・ヒベンズ酸塩

[0159]

【化30】

$$\begin{array}{c|c} \text{MeO} & \begin{array}{c} 0 \\ \vdots \\ N \\ \text{MeO} \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ \text{NC} \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ \text{NC} \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ \text{NC} \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} Pr-i \\ \text{HO} \\ \end{array} \\ \end{array} \\ \begin{array}{c} 0 \\ \text{COOH} \\ \end{array}$$

【0160】融点:118~126℃(発泡)

MS (FAB) m/z: 458 (MH-) IR (KBr) cm⁻¹: 1658,1609

【0161】実施例21

N-(2, 4, 5-hリメトキシベンゾイル) -4- [(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル] アニリン

[0162]

【化31】

$$\begin{array}{c|c} \text{MeO} & \begin{array}{c} 0 \\ C \\ N \end{array} & \begin{array}{c} 0 \\ N \end{array} & \begin{array}{c} 0 \\ N \end{array} & \begin{array}{c} Pr-1 \\ N \end{array} &$$

【0163】融点:179~181℃

MS (FAB) m/z: 458 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3350,2961,1668,1633,1610

- H - NMR (CDCl₃) δ : 1.50(12H,d),2.69~2.73(2H, m),3.02~3.12(2H,m),3.39~3.45(2H,m),3.93(3H,s),3.96(3H,s),4.06(3H,s),6.57(1H,s),6.98(1H,brs),7.72~7.81(5H,m),10.00(1H,s)

【0164】実施例22

2-[N-(3-シアノベンゾイル) アミノ] -5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニ ル] フラン・塩酸塩

[0165]

【化32】

【0166】融点:156.0~159.5℃

MS (FAB) m/z : 383 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3476, 3337, 2230, 1661, 1658, 1541, 149

- H - NMR (DMSO-d₆,60°C) δ : 1.30(6H,d),1.33(6H,d),3.10~3.25(2H,m),3.50~3.70(4H,m),6.56(1H,d),7.29(1H,d),7.72~7.78(1H,m),8.06~8.09(1H,m),8.27~8.30(1H,m),8.42~8.46(1H,m),8.60~8.68(1H,m),9.45 (1H,brs),11.91(1H,s)

【0167】実施例23

2- [N-(4-シアノベンゾイル) アミノ] -5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル) アミノカルボニル フラン・塩酸塩

[0168]

【化33】

$$\begin{array}{c|c} & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & \\ & & & \\$$

【0169】融点:113.5~117.0℃

MS (FAB) m/z : 383 (MH⁻)

IR (KBr) cm⁻¹: 3428,3310,2232,1661,1617,1541.151

- H - NMR (CDCl₃) δ : 1.42(6H,d),1.50(6H,d),3.19 \sim 3.21(2H,m),3.55 \sim 3.70(2H,m),3.80 \sim 3.90(2H,m),6.7 1(1H,d),7.23(1H,d),7.74 \sim 7.80(2H,m),8.10 \sim 8.15(2H,m),8.56 \sim 8.64(1H,m),10.38(1H,brs),11.16(1H,s)

【0170】実施例24

2- [N-(4-ニトロベンゾイル) アミノ] -5- $\lfloor (2-ジイソプロピルアミノエチル)$ アミノカルボニル $\lfloor フラン$ 塩酸塩

[0171]

【化34】

【0172】融点:130~:131℃

MS (FAB) m/z : 403 (MH⁻)

I.B. (KBr) cm⁻¹: 3422,1663,1615,1541,1522

 $^{-}$ H - N M R (CDCl₃) δ : 1.42(6H,d),1.50(6H,d),3.15 \sim 3.25(2H, m), 3.55 \sim 3.70(2H, m), 3.80 \sim 3.90(2H, m), 6.7 $3(1H,d),7.23(1H,d),8.17\sim8.33(4H,m),8.55\sim8.65(1H,d)$ m), 10.35(1H, brs), 11.38(1H, s)

【0173】実施例25

2-[N-(3-ニトロベンゾイル)アミノ]-5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル)アミノカルボニ ル]フラン・塩酸塩

[0174]

【化35】

【0178】融点:116~120℃(発泡)

MS (FAB) m/z : 373 (MH⁻)

IR (KBr) cm^{-1} : 3231,1665,1537

 $-H - NMR (DMSO-d_6) \delta : 1.01 \sim 1.08 (12H, m), 2.58 \sim$ 2.64(2H, m), $3.00\sim4.00(7H, m)$, 6.45(1H, d), 6.57(1H, s). 6.75~6.77(1H,m),7.12~7.14(4H,m),8.14(1H,brs),11. 29(IH,s)

【0179】実施例27

2-「N-(4-シアノベンゾイル)アミノ]-5-[[2-(ジイソプロピルアミノ)エトキシ]カルボニ ル] フラン

[0180]

【化37】

[0181]MS (FAB) m/z: 384 (MH+)

IR (neat) cm 1:2361,1719,1686

-H-NMR (CDCl₃) $\delta:0.99\sim1.04(12H,m),2.71\sim2$. 76(2H, m), 2.99 \sim 3.05(2H, m), 4.18(2H, t), 6.70 \sim 6.72(1

> 実施例6の化合物 酢酸ナトリウム 酢酸 (pH5.8に調整用) 蒸留水

上記処方で常法により注射剤とした。 [0185]

【0175】融点:136~438.5℃

MS (FAB) m/z : 403 (MH⁻)

I R. (KBr) cm⁻¹: 3300, 1682, 1630, 1530

 $-H - NMR (DMSO-d_G) \delta : 1.31(6H,d), 1.34(6H,d), 3.$ $10\sim3.20(2H, m)$, $3.55\sim3.70(4H, m)$, 6.58(1H, d), 7.33(1H, d)H, d) $.7.80 \sim 7.87$ (1H, m) $.8.42 \sim 8.48$ (2H, m) $.8.70 \sim 8.80$ (1H, m), 8.87~8.88(1H, m), 9.74(1H, brs), 12.12(1H, s)

【0176】実施例26

2-[N-(3-アミノベンゾイル)アミノ]-5-[(2-ジイソプロピルアミノエチル)アミノカルボニ ル フラン・1/2フマル酸塩

[0177] 【化36】

H, m), $7.20 \sim 7.24 (1H, m)$, $7.80 \sim 7.83 (2H, m)$, $8.07 \sim 8.16$ (2H, m), $10.70 \sim 11.30 (1H, m)$

【0182】製剤例1

実施例1の化合物	20 g
乳糖	315 g
トウモロコシデンプン	125 g
結晶セルロース	25 g

上記成分を均一に混合し、7.5%ヒドロキシプロピルセ ルロース水溶液200mlを加え、押出し造粒機により、直 径0.5mmスクリーンを用いて顆粒とし、直ちにマルメラ イザーにより丸めた後、乾燥して顆粒剤とした。

【0183】製剤例2

実施例2の化合物	20 g
乳糖	100 g
トウモロコシデンプン	36 g
結晶セルロース	30 g
カルボキシメチルセルロースカルシウム	10 g
ステアリン酸マグネシウム	4 g

上記組成の成分を均一に混合し、単発打錠機にて直径7. 5mmの杵で1錠200mgの錠剤とした。

【0184】製剤例3

100mg

2mg

適量

適量

計10ml/バイアル

【発明の効果】本発明の化合物は消化管運動を顕著に亢 進することにより消化管運動障害を改善し、しかも高い

1 ゼリア新薬工業株式会社中央研究所内

安全性を示すことから各種消化管運動障害の予防・治療等に有用である。

フロントページの結	き
-----------	---

(51) Int. Cl. 6 識別記号	FI
A 6 1 K 31/425	A 6 1 K 31/425
C 0 7 D 213/81	C 0 7 D 213/81
263/48	263/48
277/56	277/56
307/54	307/54
333/38	333/38
417/12 2 3 3	417/12 2 3 3
(72)発明者 中尾 竜 埼玉県大里郡江南町大字押切字沼ト 1 ゼリア新薬工業株式会社中央研	